

PCT

世界知的所有権機関
国際事務局
特許協力条約に基づいて公開された国際出願

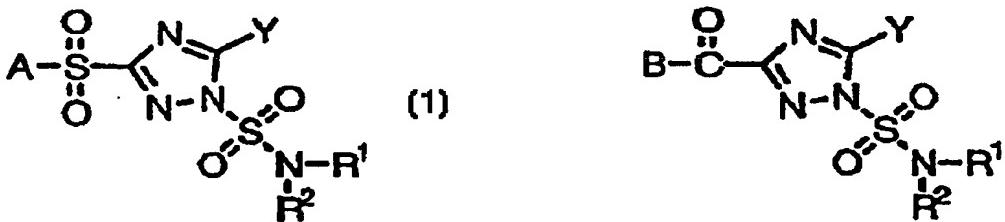


10

(51) 国際特許分類6 C07D 403/06, 403/12, 471/04, A01N 43/653, 43/84, 43/90	A1	(11) 国際公開番号 WO99/21851
		(43) 国際公開日 1999年5月6日(06.05.99)
(21) 国際出願番号 PCT/JP98/04808		山岸和宏(YAMAGISHI, Kazuhiro)[JP/JP] 西岡正憲(NISHIOKA, Masanori)[JP/JP] 鈴木博之(SUZUKI, Hiroyuki)[JP/JP]
(22) 国際出願日 1998年10月23日(23.10.98)		〒349-0294 埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama, (JP)
(30) 優先権データ 特願平9/292399 1997年10月24日(24.10.97) JP		(74) 代理人 弁理士 専 経夫, 外(HANABUSA, Tsuneo et al.) 〒101-0062 東京都千代田区神田駿河台1丁目6番地 お茶の水スクエアB館 専特許事務所内 Tokyo, (JP)
(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 日産化学工業株式会社 (NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.)[JP/JP] 〒101-0054 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1 Tokyo, (JP)		(81) 指定国 AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), ヨーラシア 特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
(72) 発明者 ; および (75) 発明者／出願人 (米国についてのみ) 武山敏明(TAKEYAMA, Toshiaki)[JP/JP] 濱田敏正(HAMADA, Toshimasa)[JP/JP] 高橋寛明(TAKAHASHI, Hiroaki)[JP/JP] 渡辺淳一(WATANABE, Junichi)[JP/JP] 〒274-8507 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社 中央研究所内 Chiba, (JP)		添付公開書類 国際調査報告書

(54)Title: SULFAMOYL COMPOUNDS AND AGRICULTURAL OR HORTICULTURAL BACTERICIDE

(54)発明の名称 スルファモイル化合物並びに農園芸用殺菌剤



(57) Abstract

Sulfamoyl compounds represented by general formula (1): wherein R¹ and R² each independently is C₁₋₄ alkyl, or R¹ and R² in combination represent C₄₋₆ alkylene or C₄₋₆ alkyleneoxy; Y is H, halogeno, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ alkylthio, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, or C₁₋₄ haloalkylthio; A is a given heterocyclic group; B is a given heterocyclic group which is the same as or different from A; W is a bond or O; V is O or S; D, E, F, and G each independently is N, CR⁷, CR⁸, CR⁹, or CR¹⁰; and R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, and R¹¹ each independently is, e.g., H or a given group such as an optionally substituted aliphatic, aromatic, or heterocyclic group. The sulfamoyl compounds are useful as an agricultural or horticultural bactericide.

明細書

スルファモイル化合物並びに農園芸用殺菌剤

技術分野

本発明は、新規なスルファモイル化合物、並びに該化合物を有効成分として含有する農薬（殺虫剤、殺菌剤、除草剤、植物生長調節剤等）、特に農園芸用殺菌剤に関するものである。

背景技術

特開平3-170464、6-32785、7-2803、7-215971号公報にはある種のスルファモイル化合物が殺菌活性を有することが記載されている。

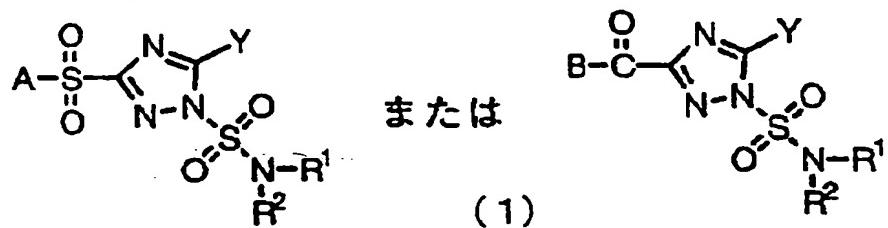
上記の公開公報に記載されている化合物においても、効力、残効性等の点で満足すべきものではなく植物病害に対して更に有用な農園芸用殺菌剤の開発が要望されている。

発明の開示

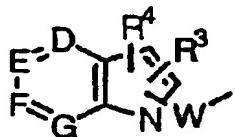
本発明者らは、このような状況に鑑み優れた殺菌剤を開発すべく種々検討を重ねた結果、新規なスルファモイル化合物が農園芸用殺菌剤として顕著な防除活性を有することを見い出し本発明に至った。

すなわち、本発明は〔1〕ないし〔38〕に関するものである。

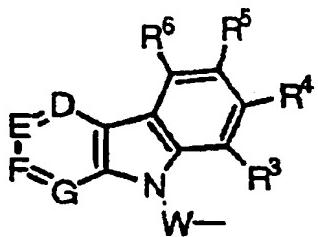
〔1〕 一般式（1）：



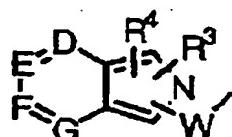
(上記式中、R¹、R²はそれぞれ独立して、C₁-、アルキルまたはR¹とR²と
が一緒になってC₂-、アルキレン、C₃-、アルキレンオキシであり、
YはH、ハロゲン、C₁-、アルキル、C₁-、アルコキシ、C₁-、アルキルチオ、
C₁-、ハロアルキル、C₁-、ハロアルコキシ、C₁-、ハロアルキルチオであり、
Aは、



A-1



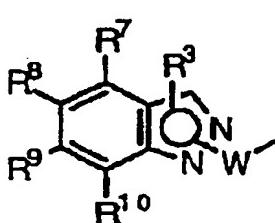
A-2



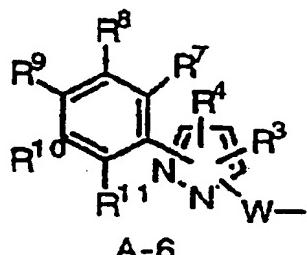
A-3



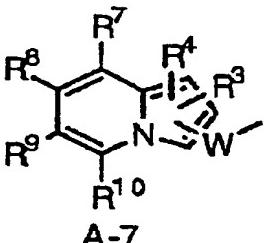
A-4



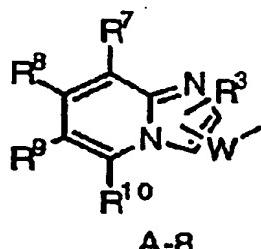
A-5



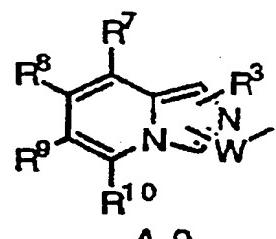
A-6



A-7

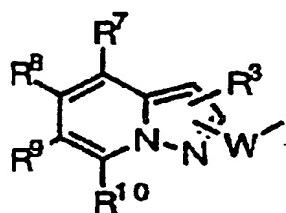


A-8



A-9

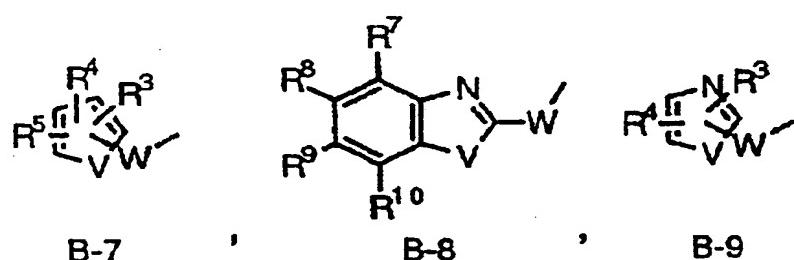
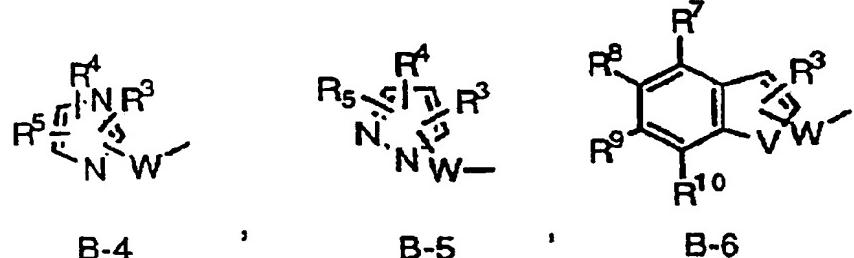
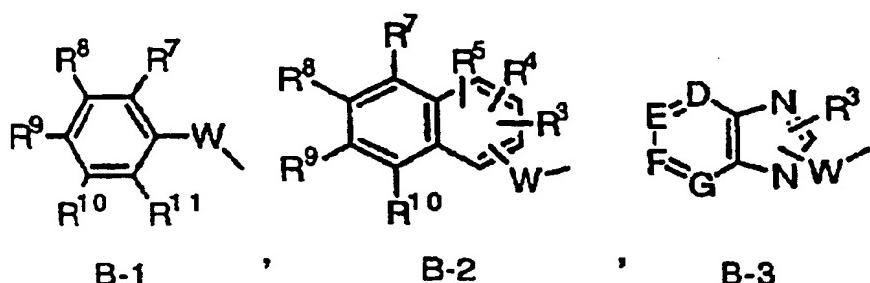
または



A-10

であり、

Bは、A-1ないしA-10、または



であり、

Wは結合またはOであり、

VはOまたはSであり、

D, E, F, Gはそれぞれ独立して、N、CR⁷、CR⁸、CR⁹ またはCR¹⁰

であり、

R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} はそれぞれ独立してH、C₁～₈アルキル、C₃～₈シクロアルキル、C₂～₈アルケニル、C₅～₈シクロアルケニル、C₂～₈アルキニル、C₁～₈アルコキシ、C₃～₈シクロアルキルオキシ、C₅～₈シクロアルケニルオキシ、C₂～₈アルケニルオキシ、C₂～₈アルキニルオキシ、C₁～₈アルキルチオ、C₃～₈シクロアルキルチオ、C₅～₈シクロアルケニルチオ、C₂～₈アルケニルチオ、C₂～₈アルキニルチオ、C₁～₈ハロアルキル、C₁～₈ハロアルコキシ、C₁～₈ハロアルキルチオ、C₂～₈ハロアルケニル、C₂～₈ハロアルケニルオキシ、C₂～₈ハロアルケニルチオ、C₂～₈ハロアルキニル、C₂～₈ハロアルキニルオキシ、C₂～₈ハロアルキニルチオ、置換されていても良いフェニル（この置換基の種類は、ハロゲン、C₁～₈アルキル、C₁～₈ハロアルキル、C₁～₈アルコキシ、C₁～₈ハロアルコキシ、C₁～₈アルキルチオ、C₁～₈ハロアルキルチオ、C₁～₆アルキルスルホキシ、C₁～₆アルキルスルホニル、CN、NO₂、C₁～₆アルコキシカルボニルであり、その置換基の数は1～5であり、その置換基は同一かもしくは相異なっていても良い）、置換されていても良いフェニルC₁～₈アルキル、置換されていても良いベンジルチオ、置換されていても良いベンジルオキシ、置換されていても良いフェノキシC₁～₈アルキル、置換されていても良いフェノキシ、置換されていても良いフェニルチオC₁～₈アルキル、置換されていても良いフェニルチオ、置換されていても良いベンゾイル、置換されていても良いベンゾイルC₁～₈アルキル、置換されていても良いベンゾイル、置換されていても良いナフチル、置換されていても良い5員もしくは6員複素環、C₁～₈ヒドロキシアルキル、C₁～₈ヒドロキシハロアルキル、C₁～₈アルコキシC₁～₈アルキル、C₁～₈ハロアルコキシC₁～₈アルキル、C₁～₈ハロアルキルチオC₁～₈アルキル、C₁～₁₀ジアルコキシC₁～₈アルキル、C₁～₈アルキレンジオキシC₁～₈アルキル、C₁～₆アルキルチオC₁～₈アルキル、C₁～₁₀ジアルキルチオC₁～₈アルキル、C₁～₈アルキレンジチオC₁～₈アルキル、C₁～₆アルコキシカルボニル、C₁～₈ハロアルコキシカルボニル、C₁～₈アルコキシオキザリル、CHO、CO₂H、C₁～₆アルコキシカルボニルC₁～₈アルキル、C₁～₈ハロアルコキシ

カルボニル C₁-₆アルキル、NH₂、C₁-₆アルキルアミノ、C₁-₆アルキルカルボニルアミノ、C₁-₆アルキルカルボニルアミノ C₁-₄アルキル、C₁-₆ハロアルキルカルボニルアミノ C₁-₄アルキル、C₁-₆アルコキシカルボニルアミノ、C₁-₆アルコキシカルボニルアミノ C₁-₄アルキル、C₁-₆アルキルスルホニルアミノ、C₁-₆アルキルスルホニルアミノ C₁-₄アルキル、C₁-₆ハロアルキルスルホニルアミノ、C₁-₆ハロアルキルスルホニルアミノ C₁-₄アルキル、C₁-₆ジアルキルアミノ、C₁-₆ジアルキルアミノ C₁-₄アルキル、C₁-₆ジアルキルアミノカルボニル、C₁-₆ジアルキルアミノカルボニル C₁-₄アルキル、C₂-₆アルキレンイミノ、C₂-₆アルキレンイミノ C₁-₄アルキル、C₂-₆アルキレンイミノカルボニル C₁-₄アルキル、C₁-₆アルキルカルボニル、C₁-₆アルキルカルボニルオキシ、C₁-₆ハロアルキルカルボニル、C₁-₆ハロアルキルカルボニルオキシ C₁-₄アルキル、C₁-₆ハロアルキルカルボニル C₁-₄アルキル、C₁-₆ハロアルキルカルボニルオキシイミノ C₁-₄アルキル、C₁-₆アルコキシイミノ C₁-₄アルキル、C₁-₆アルキルカルボニルオキシイミノ C₁-₄アルキル、C₁-₆アルキルカルボニルオキシ C₁-₄アルキル、C₁-₆アルキルスルホニルオキシイミノ C₁-₄アルキル、C₁-₆アルキルスルホキシ C₁-₄アルキル、C₁-₆ハロアルキルスルホキシ C₁-₄アルキル、C₁-₆アルキルスルホニル、C₁-₆ハロアルキルスルホニル、C₁-₆アルキルスルホニル C₁-₄アルキル、C₁-₆ハロアルキルスルホニル C₁-₄アルキル、C₁-₆アルキルスルホニルオキシ、C₁-₆ハロアルキルスルホニルオキシ、C₁-₆アルキルスルホニルオキシ C₁-₄アルキル、C₁-₆ハロアルコキシスルホニル、C₁-₆ハロアルコキシスルホニル C₁-₄アルキル、C₁-₆ジアルキルスルファモイル、C₁-₆ジアルキルスルファモイル C₁-₄アルキル、C₁-₆アルコキシスルホニル C₁-₄アルキル、C₂-₆シアノアルキル、CN、C₁-₆チオカルバモイル、C₁-₆ニトロアルキル、NO₂、ハロゲン、もしくは R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹のうちの 2つが一緒になってハロゲンで置換していく

も良いC₁～アルキレンジオキシ、またはC₂～アルキレンである。]で表されるスルファモイル化合物。

- [2] Aが、A-1である上記[1]記載のスルファモイル化合物。
- [3] Aが、A-2である上記[1]記載のスルファモイル化合物。
- [4] Aが、A-3である上記[1]記載のスルファモイル化合物。
- [5] Aが、A-4である上記[1]記載のスルファモイル化合物。
- [6] Aが、A-5またはA-6である上記[1]記載のスルファモイル化合物。
- [7] Aが、A-7またはA-8である上記[1]記載のスルファモイル化合物。
- [8] Aが、A-9またはA-10である上記[1]記載のスルファモイル化合物。
- [9] Bが、B-1である上記[1]記載のスルファモイル化合物。
- [10] Bが、B-2である上記[1]記載のスルファモイル化合物。
- [11] Bが、B-3またはB-4である上記[1]記載のスルファモイル化合物。
- [12] Bが、B-5である上記[1]記載のスルファモイル化合物。
- [13] Bが、B-6またはB-7である上記[1]記載のスルファモイル化合物。
- [14] Bが、B-8またはB-9である上記[1]記載のスルファモイル化合物。
- [15] Bが、B-10である上記[1]記載のスルファモイル化合物。
- [16] R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がC₁～アルキルチオである上記[1]記載のスルファモイル化合物。
- [17] R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がC₁～アルキルである上記[1]記載のスルファモイル化合物。
- [18] R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A

- 1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がC₁～₆ハロアルキルである上記〔1〕記載のスルファモイル化合物。

〔19〕 R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A - 1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がハロゲンである上記〔1〕記載のスルファモイル化合物。

〔20〕 R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A - 1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がHである上記〔1〕記載のスルファモイル化合物。

〔21〕 R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A - 1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がCNである上記〔1〕記載のスルファモイル化合物。

〔22〕 R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A - 2であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³, R⁴, R⁵, R⁶がいずれもHである上記〔1〕記載のスルファモイル化合物。

〔23〕 R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A - 4であり、R³, R⁴, R⁵, R⁶のうち少なくとも1つが置換されていても良い、フェニルである上記〔1〕記載のスルファモイル化合物。

〔24〕 R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Bが、B - 1である上記〔1〕記載のスルファモイル化合物。

〔25〕 R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A - 1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がC₁～₆アルキルであり、R⁴がハロゲンである上記〔1〕記載のスルファモイル化合物。

〔26〕 R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A - 1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³, R⁴がいずれもハロゲンである上記〔1〕記載のスルファモイル化合物。

〔27〕 R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A - 1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がC₁～₆アルキルであり、R⁴がHまたはC₁～₆アルキルである上記〔1〕記載のスル

ファモイル化合物。

[28] R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がC₁₋₈ハロアルキルであり、R⁴がH、ハロゲンまたはC₁₋₈アルキルである上記[1]記載のスルファモイル化合物。

[29] R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がHまたはC₁₋₈アルキルであり、R⁴がC₁₋₆アルコキシカルボニルである上記[1]記載のスルファモイル化合物。

[30] R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がHであり、R⁴がハロゲンである上記[1]記載のスルファモイル化合物。

[31] R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がCNであり、R⁴がHまたはC₁₋₈アルキルである上記[1]記載のスルファモイル化合物。

[32] R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがいずれもCHであり、R³がC₁₋₈アルキルであり、R⁴がハロゲンである上記[1]記載のスルファモイル化合物。

[33] R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがいずれもCHであり、R³, R⁴がいずれもハロゲンである上記[1]記載のスルファモイル化合物。

[34] R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GががいずれもCHであり、R³がC₁₋₈ハロアルキルであり、R⁴がHまたはC₁₋₈アルキルである上記[1]記載のスルファモイル化合物。

[35] R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがいずれもCHであり、R³がMeまたはEtであり、R⁴がCIまたはBrである上記[1]記載のスルファモイル化合物。

[36] R^1 , R^2 がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、 A_{-1} であり、D, E, F, GがいずれもCHであり、 R^3 がCIまたはBrであり、 R^4 がCIまたはBrである上記[1]記載のスルファモイル化合物。

[37] 上記[1]ないし[36]記載のスルファモイル化合物の1種以上を有効成分として含有する農薬。

[38] 農薬が、農園芸用殺菌剤である上記[37]記載の農薬。

一般式(1)の化合物において、 R^1 および R^2 の C_{1-4} アルキルとしては、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-, i-, s-ブチル等が挙げられる。

R^1 と R^2 が一緒になって C_{1-4} アルキレンとしては、例えば、 R^1 , R^2 が結合しているNを含めて、ピペリジン等が挙げられる。

R^1 と R^2 が一緒になって C_{1-4} アルキレンオキシとしては、例えば、 R^1 , R^2 が結合しているNを含めて、モルホリン等が挙げられる。

Y, R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} の各置換基の定義は以下の意味を有する。

C_{1-4} アルキルとしては、例えば、メチル、エチル、n-もしくはi-プロピル、n-もしくはi-ブチル、n-ペンチル等が挙げられる。

C_{3-6} シクロアルキルとしては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等が挙げられる。

C_{2-4} アルケニルとしては、例えば、アリル、ビニル等が挙げられる。

C_{5-6} シクロアルケニルとしては、例えば、シクロペンテニル等が挙げられる。

C_{2-4} アルキニルとしては、例えば、プロパルギル等が挙げられる。

C_{1-4} アルコキシとしては、例えば、メトキシ、エトキシ等が挙げられる。

C_{3-6} シクロアルキルオキシとしては、例えば、シクロプロピルオキシ等が挙げられる。

C_{3-6} シクロアルケニルオキシとしては、例えば、シクロペンテニル-3-オキシ等が挙げられる。

C_{2-4} アルケニルオキシとしては、例えば、アリルオキシ等が挙げられる。

C_{2-4} アルキニルオキシとしては、例えば、プロパルギルオキシ等が挙げられ

る。

C₁ - : アルキルチオとしては例えば、メチルチオ、エチルチオ、n-もしくはi-プロピルチオ等が挙げられる。

C₃ - : シクロアルキルチオとしては、例えば、シクロペンチルチオ等が挙げられる。

C₃ - : シクロアルケニルチオとしては、例えば、シクロペンテニル-3-チオ等が挙げられる。

C₂ - : アルケニルチオとしては、例えば、アリルチオ等が挙げられる。

C₂ - : アルキニルチオとしては、例えば、プロパルギルチオ等が挙げられる。

C₁ - : ハロアルコキシとしては、例えば、トリフルオロメトキシ等が挙げられる。

C₁ - : ハロアルキルチオとしては、例えば、トリフルオロメチルチオ等が挙げられる。

C₁ - : ハロアルキルとしては、例えば、クロロメチル、ジクロロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル等が挙げられる。

C₂ - : ハロアルケニルとしては、例えば、3-クロロアリル等が挙げられる。

C₂ - : ハロアルケニルオキシとしては、例えば、3-クロロアリルオキシ等が挙げられる。

C₂ - : ハロアルケニルチオとしては、例えば、3-クロロアリルチオ等が挙げられる。

C₂ - : ハロアルキニルとしては、例えば、ヨードプロパルギル等が挙げられる。

C₂ - : ハロアルキニルオキシとしては、例えば、ヨードプロパルギルオキシ等が挙げられる。

C₂ - : ハロアルキニルチオとしては、例えば、ヨードプロパルギルチオ等が挙げられる。

C₁ - : ヒドロキシアルキルとしては、例えば、ヒドロキシメチル、1-ヒドロキシエチル等が挙げられる。

C₁ - : ヒドロキシハロアルキルとしては、例えば、2, 2, 2-トリフルオロ-1-ヒドロキシエチル等が挙げられる。

C₁-_nアルコキシC₁-_nアルキルとしては、例えば、メトキシメチル、メトキシエチル等が挙げられる。

C₁-_nハロアルコキシC₁-_nアルキルとしては、例えば、トリフルオロエトキシメチル等が挙げられる。

C₁-_nアルキルチオC₁-_nアルキルとしては、例えば、メチルチオメチル、エチルチオメチル、メチルチオエチル等が挙げられる。

C₁-_nハロアルキルチオC₁-_nアルキルとしては、例えば、トリフルオロエチルチオメチル等が挙げられる。

C₁-_nジアルコキシC₁-_nアルキルとしては、例えば、ジメトキシメチル、ジエトキシメチル等が挙げられる。

C₁-_nジアルキルチオC₁-_nアルキルとしては、例えば、ジメチルチオメチル、ジエチルチオメチル等が挙げられる。

C₁-_nアルキレンジオキシC₁-_nアルキルとしては、例えば、エチレンジオキシメチル等が挙げられる。

C₁-_nアルキレンジチオC₁-_nアルキルとしては、例えば、エチレンジチオメチル等が挙げられる。

置換されていても良いフェノキシC₁-_nアルキルとしては、例えば、フェノキシメチル等が挙げられる。

置換されていても良いフェノキシとしては、例えば、フェノキシ等が挙げられる。

置換されていても良いフェニルチオC₁-_nアルキルとしては、例えば、フェニルチオメチル等が挙げられる。

置換されていても良いフェニルチオとしては、例えば、フェニルチオ等が挙げられる。

置換されていても良いフェニルC₁-_nアルキルとしては、例えば、ベンジル、フェネチル等が挙げられる。

置換されていても良いベンジルチオとしては、例えば、ベンジルチオ等が挙げられる。

置換されていても良いベンジルオキシとしては、例えば、ベンジルオキシ等が

挙げられる。

置換されていても良いフェニルとしては、例えば、フェニル等が挙げられる。

置換されていても良いベンゾイルとしては、例えば、ベンゾイル等が挙げられる。

置換されていても良いベンゾイルC₁-、アルキルとしては、例えば、ベンゾイルメチル等が挙げられる。

置換されていても良いベンゾイルオキシとしては、例えば、ベンゾイルオキシ等が挙げられる。

置換されていても良いベンゾイルオキシC₁-、アルキルとしては、例えば、ベンゾイルオキシメチル等が挙げられる。

置換されていても良いナフチルとしては、例えば、ナフチル等が挙げられる。

置換されていても良い5員もしくは6員複素環としては、例えば、ピリジン、チオフェン、フラン、チアゾール等が挙げられる。

C₁-、アルコキシカルボニルとしては、例えば、メトキシカルボニル等が挙げられる。

C₁-、アルコキシカルボニルC₁-、アルキルとしては、例えば、メトキシカルボニルメチル等が挙げられる。

C₁-、ハロアルコキシカルボニルとしては、例えば、フルオロエトキシカルボニル等が挙げられる。

C₁-、ハロアルコキシカルボニルC₁-、アルキルとしては、例えば、フルオロエトキシカルボニルメチル等が挙げられる。

C₁-、アルコキシオキザリルとしては、例えば、メトキシオキザリル、エトキシオキザリル等が挙げられる。

C₁-、ジアルキルアミノとしては、例えば、ジメチルアミノ等が挙げられる。

C₁-、アルキルアミノとしては、例えば、メチルアミノ等が挙げられる。

C₁-、ジアルキルアミノC₁-、アルキルとしては、例えば、ジメチルアミノメチル等が挙げられる。

C₂-、アルキレンイミノとしては、例えば、ピロリジノ、ピペリジノ等が挙げられる。

C₂～₆アルキレンイミノカルボニルとしては、例えば、ピロリジノカルボニル、ピペリジノカルボニル等が挙げられる。

C₂～₆アルキレンイミノC₁～₄アルキルとしては、例えば、ピロリジノメチル、ピペリジノメチル等が挙げられる。

C₂～₆アルキレンイミノカルボニルC₁～₄アルキルとしては、例えば、ピロリジノカルボニルメチル、ピペリジノカルボニルメチル等が挙げられる。

C₁～₆アルキルカルボニルアミノとしては、例えば、アセチルアミノ等が挙げられる。

C₁～₆アルコキシカルボニルアミノとしては、例えば、メトキシカルボニルアミノ等が挙げられる。

C₁～₆ハロアルキルカルボニルアミノとしては、例えば、トリフルオロアセチルアミノ等が挙げられる。

C₁～₆アルキルスルホニルアミノとしては、例えば、メタンスルホニルアミノ等が挙げられる。

C₁～₆ハロアルキルスルホニルアミノとしては、例えば、クロロメチルスルホニルアミノ等が挙げられる。

C₁～₆アルキルカルボニルアミノC₁～₄アルキルとしては、例えば、アセチルアミノメチル等が挙げられる。

C₁～₆アルコキシカルボニルアミノC₁～₄アルキルとしては、例えば、メトキシカルボニルアミノメチル等が挙げられる。

C₁～₆ハロアルキルカルボニルアミノC₁～₄アルキルとしては、例えば、トリフルオロアセチルアミノメチル等が挙げられる。

C₁～₆アルキルスルホニルアミノC₁～₄アルキルとしては、例えば、メタンスルホニルアミノメチル等が挙げられる。

C₁～₆ハロアルキルスルホニルアミノC₁～₄アルキルとしては、例えば、クロロメチルスルホニルアミノメチル等が挙げられる。

C₁～₆ジアルキルアミノカルボニルとしては、例えば、ジメチルアミノカルボニル等が挙げられる。

C₁～₆ジアルキルアミノカルボニルC₁～₄アルキルとしては、例えば、ジメチ

ルアミノカルボニルメチル等が挙げられる。

C₁-₆アルキルカルボニルとしては、例えば、アセチル等が挙げられる。

C₁-₆ハロアルキルカルボニルとしては、例えば、トリフルオロアセチル等が挙げられる。

C₁-₆アルキルカルボニルオキシとしては、例えば、アセチルオキシ等が挙げられる。

C₁-₆ハロアルキルカルボニルオキシとしては、例えば、トリフルオロアセチルオキシ等が挙げられる。

C₁-₆アルキルカルボニルC₁-₆アルキルとしては、例えば、アセチルメチル等が挙げられる。

C₁-₆ハロアルキルカルボニルC₁-₆アルキルとしては、例えば、トリフルオロアセチルメチル等が挙げられる。

C₁-₆アルキルカルボニルオキシC₁-₆アルキルとしては、例えば、アセチルオキシメチル等が挙げられる。

C₁-₆ハロアルキルカルボニルオキシC₁-₆アルキルとしては、例えば、トリフルオロアセチルオキシメチル等が挙げられる。

ヒドロキシイミノC₁-₆アルキルとしては、例えば、ヒドロキシイミノメチル等が挙げられる。

C₁-₆アルコキシイミノC₁-₆アルキルとしては、例えば、メトキシイミノメチル等が挙げられる。

C₁-₆アルキルカルボニルオキシイミノC₁-₆アルキルとしては、例えば、アセチルオキシイミノメチル等が挙げられる。

C₁-₆アルキルスルホニルオキシイミノC₁-₆アルキルとしては、例えば、メタンスルホニルオキシイミノメチル等が挙げられる。

C₁-₆アルキルスルホキシとしては、例えば、メチルスルホキシ等が挙げられる。

C₁-₆アルキルスルホキシC₁-₆アルキルとしては、例えば、メチルスルホキシメチル、エチルスルホキシメチル、メチルスルホキシエチル等が挙げられる。

C₁-₆アルキルスルホニルとしては、例えば、メタンスルホニル等が挙げられ

る。

C₁-₆アルキルスルホニルオキシとしては、例えば、メタンスルホニルオキシ等が挙げられる。

C₁-₆アルキルスルホニルC₁-₆アルキルとしては、例えば、メチルスルホニルメチル、エチルスルホニルメチル、メチルスルホニルエチル等が挙げられる。

C₁-₆アルキルスルホニルオキシC₁-₆アルキルとしては、例えば、メチルスルホニルオキシメチル等が挙げられる。

C₁-₆ハロアルキルスルホキシとしては、例えば、クロロメチルスルホキシ等が挙げられる。

C₁-₆ハロアルキルスルホキシC₁-₆アルキルとしては、例えば、クロロメチルスルホキシメチル等が挙げられる。

C₁-₆ハロアルキルスルホニルとしては、例えば、トリフルオロメチルスルホニル等が挙げられる。

C₁-₆ハロアルキルスルホニルオキシとしては、例えば、トリフルオロメチルスルホニルオキシ等が挙げられる。

C₁-₆ハロアルキルスルホニルC₁-₆アルキルとしては、例えば、トリフルオロメチルスルホニルメチル等が挙げられる。

C₁-₆ハロアルキルスルホニルオキシC₁-₆アルキルとしては、例えば、トリフルオロメチルスルホニルオキシメチル等が挙げられる。

C₁-₆ジアルキルスルファモイルとしては、例えば、ジメチルスルファモイル等が挙げられる。

C₁-₆ジアルキルスルファモイルC₁-₆アルキルとしては、例えば、ジメチルスルファモイルメチル等が挙げられる。

C₁-₆アルコキシスルホニルとしては、例えば、メトキシスルホニル等が挙げられる。

C₁-₆アルコキシスルホニルC₁-₆アルキルとしては、例えば、メトキシスルホニルメチル等が挙げられる。

C₁-₆ハロアルコキシスルホニルとしては、例えば、フルオロエトキシスルホニル等が挙げられる。

C₁-: ハロアルコキシルホニルC₁-: アルキルとしては、例えば、フルオロエトキシルホニルメチル等が挙げられる。

C₁-: ニトロアルキルとしては、例えば、ニトロメチル等が挙げられる。

C₂-: シアノアルキルとしては、例えば、シアノメチル等が挙げられる。

C₁-: チオカルバモイルとしては、例えば、CSNH₂等が挙げられる。

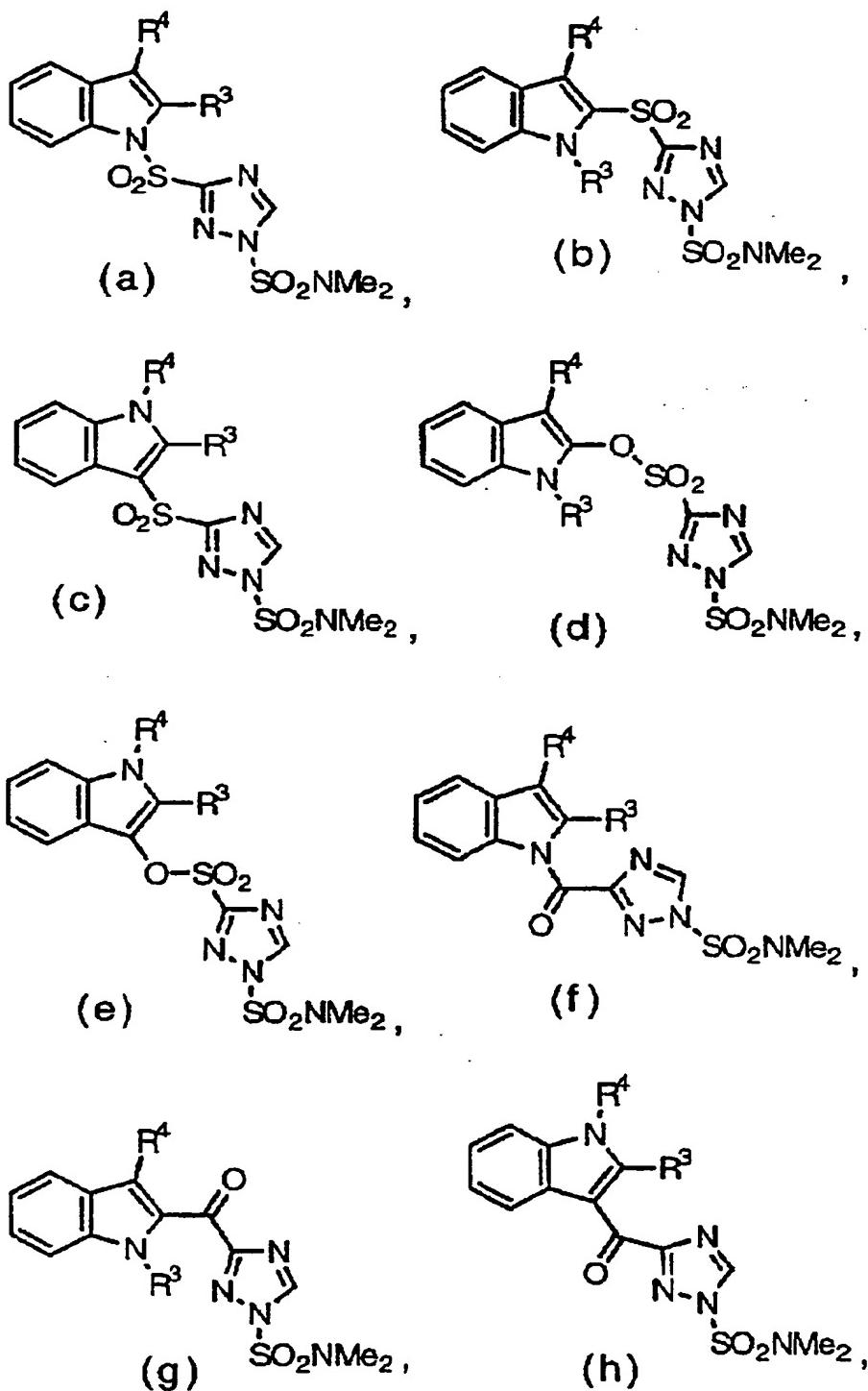
ハロゲンとしては、F、Cl、Br、Iが挙げられる。

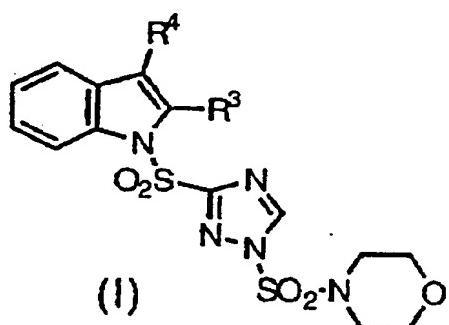
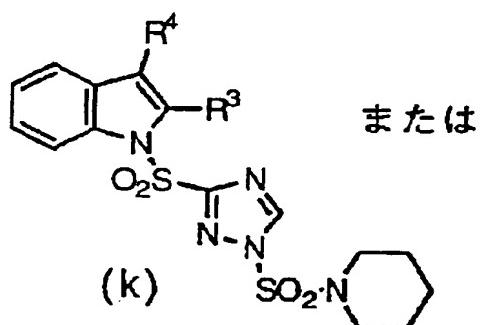
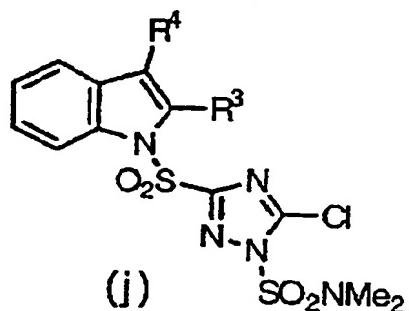
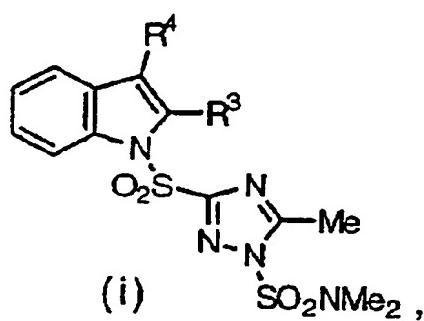
ハロゲンで置換されていても良いC₁-: アルキレンジオキシとしては、例えば、ジフルオロメチレンジオキシ、テトラフルオロエチレンジオキシ等が挙げられる。

次に式(1)で表される本発明化合物を、第1表から第11表に示す。但し、本発明化合物はこれらのみに限定されるものではない。

なお、表中のMeはメチルを、Etはエチルを、Prはプロピルを、Buはブチルを、n-はノルマルを、i-はイソを、s-はセカンダリーを、t-はターシャリーを、Phはフェニルを、Bnはベンジルを、Acはアセチルを示す。

第 1 表





化合物No	R ³	R ⁴
1 - 1	H	H
1 - 2	Me	H
1 - 3	Et	H
1 - 4	n - Pr	H
1 - 5	i - Pr	H
1 - 6	n - Bu	H
1 - 7	Ph	H
1 - 8	Bn	H
1 - 9	F	H
1 - 10	Cl	H
1 - 11	Br	H
1 - 12	I	H
1 - 13	SMe	H
1 - 14	SEt	H
1 - 15	CH ₂ OMe	H
1 - 16	CClF ₂	H
1 - 17	CHF ₂	H
1 - 18	CHFCI	H
1 - 19	CH ₂ Cl	H

第 1 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴
1 - 20	CF ₃	H
1 - 21	CN	H
1 - 22	CHO	H
1 - 23	C ₂ F ₅	H
1 - 24	CH=NOMe	H
1 - 25	CO ₂ Me	H
1 - 26	CO ₂ Et	H
1 - 27	CONMe ₂	H
1 - 28	COMe	H
1 - 29	COPh	H
1 - 30	CH ₂ CO ₂ Me	H
1 - 31	NO ₂	H
1 - 32	H	C1
1 - 33	Me	C1
1 - 34	Et	C1
1 - 35	n - Pr	C1
1 - 36	i - Pr	C1
1 - 37	n - Bu	C1
1 - 38	Ph	C1
1 - 39	Bn	C1
1 - 40	F	C1
1 - 41	Cl	C1
1 - 42	Br	C1
1 - 43	I	C1
1 - 44	SMe	C1
1 - 45	SEt	C1
1 - 46	CH ₂ OMe	C1
1 - 47	CHF ₂	C1
1 - 48	CHFC1	C1
1 - 49	CH ₂ Cl	C1
1 - 50	CF ₃	C1
1 - 51	CN	C1
1 - 52	CHO	C1
1 - 53	C ₂ F ₅	C1
1 - 54	CH=NOMe	C1
1 - 55	CO ₂ Me	C1
1 - 56	CO ₂ Et	C1
1 - 57	CONMe ₂	C1
1 - 58	COMe	C1
1 - 59	CC1F ₂	C1
1 - 60	CH ₂ CO ₂ Me	C1
1 - 61	NO ₂	C1
1 - 62	H	Br
1 - 63	Me	Br

第 1 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴
1 - 64	Et	Br
1 - 65	n - Pr	Br
1 - 66	i - Pr	Br
1 - 67	n - Bu	Br
1 - 68	Ph	Br
1 - 69	Bn	Br
1 - 70	F	Br
1 - 71	Cl	Br
1 - 72	Br	Br
1 - 73	I	Br
1 - 74	SMe	Br
1 - 75	SEt	Br
1 - 76	CH ₂ OMe	Br
1 - 77	CHF ₂	Br
1 - 78	CHFC1	Br
1 - 79	CH ₂ Cl	Br
1 - 80	CF ₃	Br
1 - 81	CN	Br
1 - 82	CHO	Br
1 - 83	C ₂ F ₅	Br
1 - 84	CH=NOMe	Br
1 - 85	CO ₂ Me	Br
1 - 86	CO ₂ Et	Br
1 - 87	CONMe ₂	Br
1 - 88	COMe	Br
1 - 89	CC1F ₂	Br
1 - 90	CH ₂ CO ₂ Me	Br
1 - 91	NO ₂	Br
1 - 92	H	I
1 - 93	Me	I
1 - 94	Et	I
1 - 95	n - Pr	I
1 - 96	n - Bu	I
1 - 97	Ph	I
1 - 98	F	I
1 - 99	Cl	I
1 - 100	Br	I
1 - 101	I	I
1 - 102	SMe	I
1 - 103	CF ₃	I
1 - 104	CN	I
1 - 105	H	F
1 - 106	Me	F
1 - 107	Et	F

第 1 表 (続 き)

化合物 N o	R ³	R ⁴
1 - 108	n - Pr	F
1 - 109	n - Bu	F
1 - 110	Ph	F
1 - 111	F	F
1 - 112	Cl	F
1 - 113	Br	F
1 - 114	CO ₂ Et	F
1 - 115	SMe	F
1 - 116	CF ₃	F
1 - 117	CN	F
1 - 118	H	Me
1 - 119	Me	Me
1 - 120	Et	Me
1 - 121	n - Pr	Me
1 - 122	CF ₂ Cl	Me
1 - 123	CHF ₂	Me
1 - 124	F	Me
1 - 125	Cl	Me
1 - 126	Br	Me
1 - 127	I	Me
1 - 128	SMe	Me
1 - 129	CF ₃	Me
1 - 130	CN	Me
1 - 131	CHO	Me
1 - 132	CH=NOH	Me
1 - 133	CH=NOMe	Me
1 - 134	CH=NOAc	Me
1 - 135	H	Et
1 - 136	Me	Et
1 - 137	Et	Et
1 - 138	n - Pr	Et
1 - 139	F	Et
1 - 140	Cl	Et
1 - 141	Br	Et
1 - 142	CHF ₂	Et
1 - 143	CClF ₂	Et
1 - 144	CF ₃	Et
1 - 145	CN	Et
1 - 146	CHO	Et
1 - 147	- (CH ₂) ₃ -	
1 - 148	- (CH ₂) ₄ -	
1 - 149	- (CH ₂) ₅ -	
1 - 150	- (CH ₂) ₆ -	
1 - 151	H	Ph

第 1 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴
1 - 152	Me	Ph
1 - 153	Et	Ph
1 - 154	n - Pr	Ph
1 - 155	F	Ph
1 - 156	Cl	Ph
1 - 157	Br	Ph
1 - 158	I	Ph
1 - 159	SMe	Ph
1 - 160	CF ₃	Ph
1 - 161	CN	Ph
1 - 162	CHO	Ph
1 - 163	H	Bn
1 - 164	Me	Bn
1 - 165	Et	Bn
1 - 166	n - Pr	Bn
1 - 167	F	Bn
1 - 168	Cl	Bn
1 - 169	Br	Bn
1 - 170	I	Bn
1 - 171	SMe	Bn
1 - 172	CF ₃	Bn
1 - 173	CN	Bn
1 - 174	H	CF ₃
1 - 175	Me	CF ₃
1 - 176	Et	CF ₃
1 - 177	n - Pr	CF ₃
1 - 178	n - Bu	CF ₃
1 - 179	Ph	CF ₃
1 - 180	F	CF ₃
1 - 181	Cl	CF ₃
1 - 182	Br	CF ₃
1 - 183	I	CF ₃
1 - 184	SMe	CF ₃
1 - 185	CF ₃	CF ₃
1 - 186	CN	CF ₃
1 - 187	H	CHO
1 - 188	Me	CHO
1 - 189	Et	CHO
1 - 190	n - Pr	CHO
1 - 191	n - Bu	CHO
1 - 192	F	CHO
1 - 193	Cl	CHO
1 - 194	Br	CHO
1 - 195	I	CHO

第 1 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴
1 - 196	SMe	CHO
1 - 197	CF ₃	CHO
1 - 198	CN	CHO
1 - 199	H	CH=NOH
1 - 200	Me	CH=NOH
1 - 201	Et	CH=NOH
1 - 202	n - Pr	CH=NOH
1 - 203	F	CH=NOH
1 - 204	Cl	CH=NOH
1 - 205	Br	CH=NOH
1 - 206	I	CH=NOH
1 - 207	SMe	CH=NOH
1 - 208	CF ₃	CH=NOH
1 - 209	CN	CH=NOH
1 - 210	H	CH=NOMe
1 - 211	Me	CH=NOMe
1 - 212	Et	CH=NOMe
1 - 213	n - Pr	CH=NOMe
1 - 214	F	CH=NOMe
1 - 215	Cl	CH=NOMe
1 - 216	Br	CH=NOMe
1 - 217	I	CH=NOMe
1 - 218	SMe	CH=NOMe
1 - 219	CF ₃	CH=NOMe
1 - 220	CN	CH=NOMe
1 - 221	H	CH=NOAc
1 - 222	Me	CH=NOAc
1 - 223	Et	CH=NOAc
1 - 224	n - Pr	CH=NOAc
1 - 225	F	CH=NOAc
1 - 226	Cl	CH=NOAc
1 - 227	Br	CH=NOAc
1 - 228	I	CH=NOAc
1 - 229	SMe	CH=NOAc
1 - 230	CF ₃	CH=NOAc
1 - 231	CN	CH=NOAc
1 - 232	H	COMe
1 - 233	Me	COMe
1 - 234	Et	COMe
1 - 235	n - Pr	COMe
1 - 236	n - Bu	COMe
1 - 237	F	COMe
1 - 238	Cl	COMe
1 - 239	Br	COMe

第 1 表 (続 き)

化合物 No	R ³	R ⁴
1 - 240	I	COMe
1 - 241	SMe	COMe
1 - 242	CF ₃	COMe
1 - 243	CN	COMe
1 - 244	H	COEt
1 - 245	Me	COEt
1 - 246	Et	COEt
1 - 247	n - Pr	COEt
1 - 248	n - Bu	COEt
1 - 249	Ph	COEt
1 - 250	F	COEt
1 - 251	Cl	COEt
1 - 252	Br	COEt
1 - 253	I	COEt
1 - 254	SMe	COEt
1 - 255	CF ₃	COEt
1 - 256	CN	COEt
1 - 257	H	COPh
1 - 258	Me	COPh
1 - 259	Et	COPh
1 - 260	n - Pr	COPh
1 - 261	F	COPh
1 - 262	Cl	COPh
1 - 263	Br	COPh
1 - 264	I	COPh
1 - 265	H	COCF ₃
1 - 266	Me	COCF ₃
1 - 267	Et	COCF ₃
1 - 268	n - Pr	COCF ₃
1 - 269	F	COCF ₃
1 - 270	Cl	COCF ₃
1 - 271	Br	COCF ₃
1 - 272	I	COCF ₃
1 - 273	SMe	COCF ₃
1 - 274	CF ₃	COCF ₃
1 - 275	CN	COCF ₃
1 - 276	H	CO ₂ Me
1 - 277	Me	CO ₂ Me
1 - 278	Et	CO ₂ Me
1 - 279	n - Pr	CO ₂ Me
1 - 280	n - Bu	CO ₂ Me
1 - 281	Ph	CO ₂ Me
1 - 282	F	CO ₂ Me
1 - 283	Cl	CO ₂ Me

第 1 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴
1 - 284	Br	CO ₂ Me
1 - 285	I	CO ₂ Me
1 - 286	SMe	CO ₂ Me
1 - 287	CF ₃	CO ₂ Me
1 - 288	CN	CO ₂ Me
1 - 289	H	CO ₂ Et
1 - 290	Me	CO ₂ Et
1 - 291	Et	CO ₂ Et
1 - 292	F	CO ₂ Et
1 - 293	Cl	CO ₂ Et
1 - 294	Br	CO ₂ Et
1 - 295	SMe	CO ₂ Et
1 - 296	CF ₃	CO ₂ Et
1 - 297	CN	CO ₂ Et
1 - 298	H	CO ₂ n - Pr
1 - 299	Me	CO ₂ n - Pr
1 - 300	Et	CO ₂ n - Pr
1 - 301	F	CO ₂ n - Pr
1 - 302	Cl	CO ₂ n - Pr
1 - 303	Br	CO ₂ n - Pr
1 - 304	SMe	CO ₂ n - Pr
1 - 305	CF ₃	CO ₂ n - Pr
1 - 306	CN	CO ₂ n - Pr
1 - 307	H	CO ₂ i - Pr
1 - 308	Me	CO ₂ i - Pr
1 - 309	Et	CO ₂ i - Pr
1 - 310	F	CO ₂ i - Pr
1 - 311	Cl	CO ₂ i - Pr
1 - 312	Br	CO ₂ i - Pr
1 - 313	SMe	CO ₂ i - Pr
1 - 314	CF ₃	CO ₂ i - Pr
1 - 315	CN	CO ₂ i - Pr
1 - 316	H	CO ₂ n - Bu
1 - 317	Me	CO ₂ n - Bu
1 - 318	Et	CO ₂ n - Bu
1 - 319	F	CO ₂ n - Bu
1 - 320	Cl	CO ₂ n - Bu
1 - 321	Br	CO ₂ n - Bu
1 - 322	SMe	CO ₂ n - Bu
1 - 323	CF ₃	CO ₂ n - Bu
1 - 324	CN	CO ₂ n - Bu
1 - 325	H	CO ₂ i - Bu
1 - 326	Me	CO ₂ i - Bu
1 - 327	Et	CO ₂ i - Bu

第 1 表 (続 き)

化合物 N o	R ³	R ⁴
1 - 328	F	CO ₂ i - Bu
1 - 329	Cl	CO ₂ i - Bu
1 - 330	Br	CO ₂ i - Bu
1 - 331	SMe	CO ₂ i - Bu
1 - 332	CF ₃	CO ₂ i - Bu
1 - 333	CN	CO ₂ i - Bu
1 - 334	H	CO ₂ s - Bu
1 - 335	Me	CO ₂ s - Bu
1 - 336	Et	CO ₂ s - Bu
1 - 337	F	CO ₂ s - Bu
1 - 338	Cl	CO ₂ s - Bu
1 - 339	Br	CO ₂ s - Bu
1 - 340	SMe	CO ₂ s - Bu
1 - 341	CF ₃	CO ₂ s - Bu
1 - 342	CN	CO ₂ s - Bu
1 - 343	H	CO ₂ t - Bu
1 - 344	Me	CO ₂ t - Bu
1 - 345	Et	CO ₂ t - Bu
1 - 346	F	CO ₂ t - Bu
1 - 347	Cl	CO ₂ t - Bu
1 - 348	Br	CO ₂ t - Bu
1 - 349	SMe	CO ₂ t - Bu
1 - 350	CF ₃	CO ₂ t - Bu
1 - 351	CN	CO ₂ t - Bu
1 - 352	H	CO ₂ Ph
1 - 353	Me	CO ₂ Ph
1 - 354	Et	CO ₂ Ph
1 - 355	F	CO ₂ Ph
1 - 356	Cl	CO ₂ Ph
1 - 357	Br	CO ₂ Ph
1 - 358	SMe	CO ₂ Ph
1 - 359	CF ₃	CO ₂ Ph
1 - 360	CN	CO ₂ Ph
1 - 361	H	COCO ₂ Me
1 - 362	Me	COCO ₂ Me
1 - 363	F	COCO ₂ Me
1 - 364	Cl	COCO ₂ Me
1 - 365	Br	COCO ₂ Me
1 - 366	SMe	COCO ₂ Me
1 - 367	CF ₃	COCO ₂ Me
1 - 368	CN	COCO ₂ Me
1 - 369	H	COCO ₂ Et
1 - 370	Me	COCO ₂ Et
1 - 371	F	COCO ₂ Et

第 1 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴
1 - 372	C1	COCO ₂ Et
1 - 373	Br	COCO ₂ Et
1 - 374	SMe	COCO ₂ Et
1 - 375	CF ₃	COCO ₂ Et
1 - 376	CN	COCO ₂ Et
1 - 377	H	SMe
1 - 378	Me	SMe
1 - 379	Et	SMe
1 - 380	n - Pr	SMe
1 - 381	F	SMe
1 - 382	C1	SMe
1 - 383	Br	SMe
1 - 384	I	SMe
1 - 385	SMe	SMe
1 - 386	CF ₃	SMe
1 - 387	CN	SMe
1 - 388	H	SO ₂ Me
1 - 389	Me	SO ₂ Me
1 - 390	Et	SO ₂ Me
1 - 391	C1	SO ₂ Me
1 - 392	Br	SO ₂ Me
1 - 393	CF ₃	SO ₂ Me
1 - 394	CN	SO ₂ Me
1 - 395	H	SO ₂ Me
1 - 396	Me	SO ₂ Me
1 - 397	Et	SO ₂ Me
1 - 398	C1	SO ₂ Me
1 - 399	Br	SO ₂ Me
1 - 400	CF ₃	SO ₂ Me
1 - 401	CN	SO ₂ Me
1 - 402	H	SPh
1 - 403	Me	SPh
1 - 404	Et	SPh
1 - 405	n - Pr	SPh
1 - 406	F	SPh
1 - 407	C1	SPh
1 - 408	Br	SPh
1 - 409	I	SPh
1 - 410	SMe	SPh
1 - 411	CF ₃	SPh
1 - 412	CN	SPh
1 - 413	H	SOPh
1 - 414	Me	SOPh
1 - 415	Et	SOPh

第 1 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴
1 - 416	Cl	SOPh
1 - 417	Br	SOPh
1 - 418	CF ₃	SOPh
1 - 419	CN	SOPh
1 - 420	H	SO ₂ Ph
1 - 421	Me	SO ₂ Ph
1 - 422	Et	SO ₂ Ph
1 - 423	Cl	SO ₂ Ph
1 - 424	Br	SO ₂ Ph
1 - 425	CF ₃	SO ₂ Ph
1 - 426	CN	SO ₂ Ph
1 - 427	H	NO ₂
1 - 428	Me	NO ₂
1 - 429	Et	NO ₂
1 - 430	Cl	NO ₂
1 - 431	Br	NO ₂
1 - 432	SMe	NO ₂
1 - 433	CF ₃	NO ₂
1 - 434	CN	NO ₂
1 - 435	H	CN
1 - 436	Me	CN
1 - 437	Et	CN
1 - 438	n - Pr	CN
1 - 439	F	CN
1 - 440	Cl	CN
1 - 441	Br	CN
1 - 442	SMe	CN
1 - 443	CF ₃	CN
1 - 444	CN	CN
1 - 445	H	CH ₂ CN
1 - 446	Me	CH ₂ CN
1 - 447	Et	CH ₂ CN
1 - 448	n - Pr	CH ₂ CN
1 - 449	Cl	CH ₂ CN
1 - 450	Br	CH ₂ CN
1 - 451	SMe	CH ₂ CN
1 - 452	CF ₃	CH ₂ CN
1 - 453	CN	CH ₂ CN
1 - 454	H	OMe
1 - 455	Me	OMe
1 - 456	Et	OMe
1 - 457	Cl	OMe
1 - 458	Br	OMe
1 - 459	SMe	OMe

第 1 表 (続 き)

化合物 N o	R ³	R ⁴
1 - 460	CF ₃	OMe
1 - 461	CN	OMe
1 - 462	H	CH ₂ NMe ₂
1 - 463	Me	CH ₂ NMe ₂
1 - 464	Et	CH ₂ NMe ₂
1 - 465	Cl	CH ₂ NMe ₂
1 - 466	Br	CH ₂ NMe ₂
1 - 467	SMe	CH ₂ NMe ₂
1 - 468	CF ₃	CH ₂ NMe ₂
1 - 469	CN	CH ₂ NMe ₂
1 - 470	H	OCOMe
1 - 471	Me	OCOMe
1 - 472	Et	OCOMe
1 - 473	Cl	OCOMe
1 - 474	Br	OCOMe
1 - 475	SMe	OCOMe
1 - 476	CF ₃	OCOMe
1 - 477	CN	OCOMe
1 - 478	H	CH(OMe) ₂
1 - 479	Me	CH(OMe) ₂
1 - 480	Et	CH(OMe) ₂
1 - 481	n - Pr	CH(OMe) ₂
1 - 482	Cl	CH(OMe) ₂
1 - 483	Br	CH(OMe) ₂
1 - 484	SMe	CH(OMe) ₂
1 - 485	CF ₃	CH(OMe) ₂
1 - 486	CN	CH(OMe) ₂
1 - 487	H	CH(SMe) ₂
1 - 488	Me	CH(SMe) ₂
1 - 489	Et	CH(SMe) ₂
1 - 490	n - Pr	CH(SMe) ₂
1 - 491	Cl	CH(SMe) ₂
1 - 492	Br	CH(SMe) ₂
1 - 493	SMe	CH(SMe) ₂
1 - 494	CF ₃	CH(SMe) ₂
1 - 495	CN	CH(SMe) ₂
1 - 496	H	CH ₂ Cl
1 - 497	Me	CH ₂ Cl
1 - 498	Et	CH ₂ Cl
1 - 499	n - Pr	CH ₂ Cl
1 - 500	F	CH ₂ Cl
1 - 501	Cl	CH ₂ Cl
1 - 502	Br	CH ₂ Cl
1 - 503	I	CH ₂ Cl

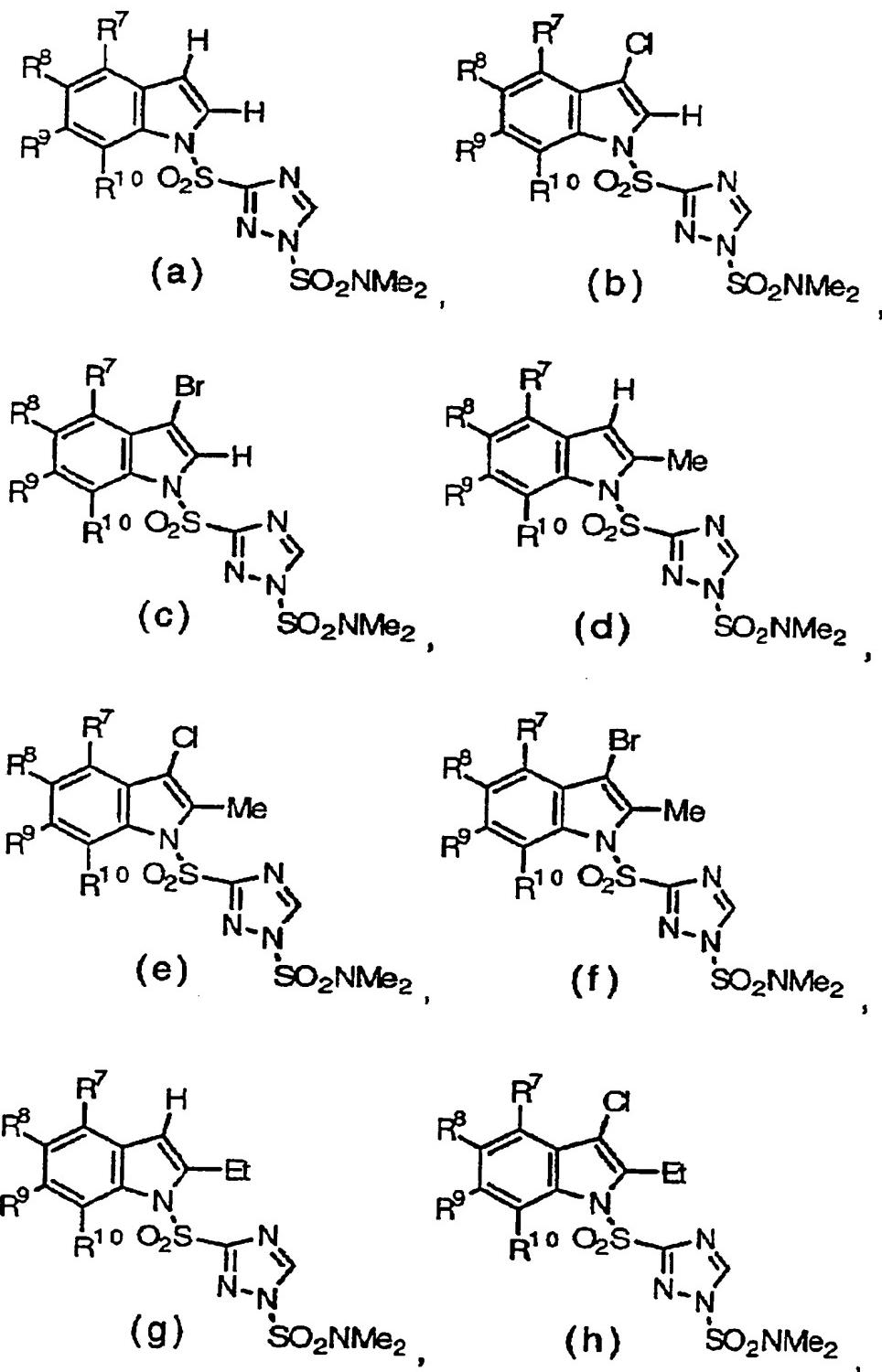
第 1 表 (続 き)

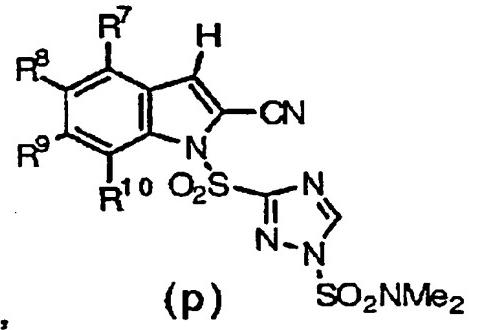
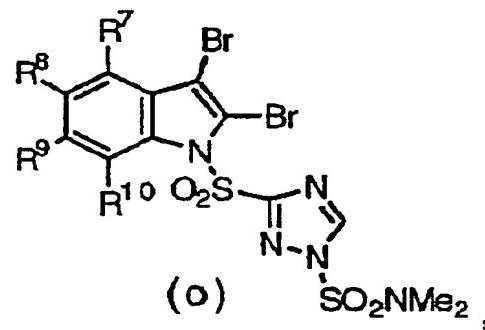
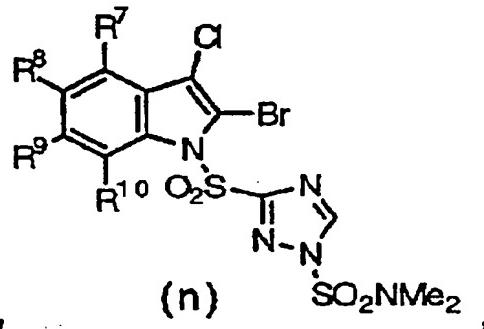
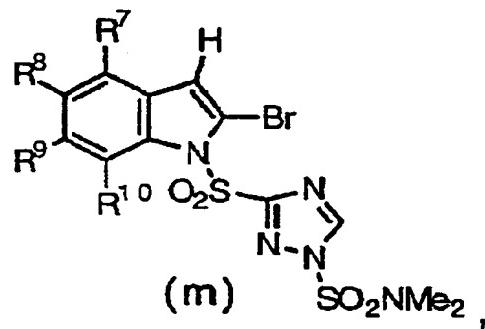
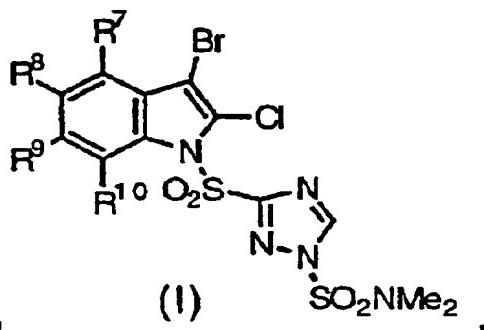
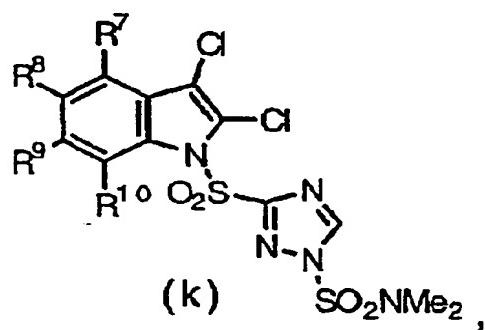
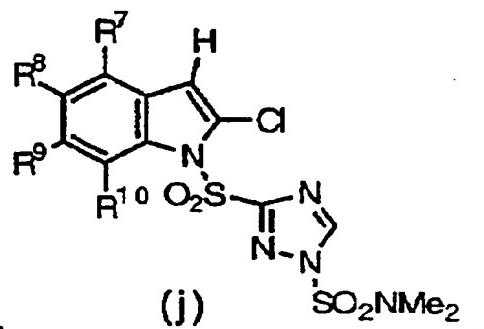
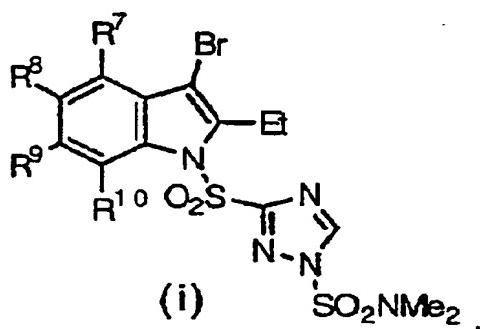
化合物 N o	R ³	R ⁴
1 - 504	SMe	CH ₂ Cl
1 - 505	CF ₃	CH ₂ Cl
1 - 506	CN	CH ₂ Cl
1 - 507	H	CH ₂ OH
1 - 508	Me	CH ₂ OH
1 - 509	Et	CH ₂ OH
1 - 510	n - Pr	CH ₂ OH
1 - 511	F	CH ₂ OH
1 - 512	Cl	CH ₂ OH
1 - 513	Br	CH ₂ OH
1 - 514	SMe	CH ₂ OH
1 - 515	CF ₃	CH ₂ OH
1 - 516	CN	CH ₂ OH
1 - 517	H	CH(OH)Me
1 - 518	Me	CH(OH)Me
1 - 519	Et	CH(OH)Me
1 - 520	n - Pr	CH(OH)Me
1 - 521	F	CH(OH)Me
1 - 522	Cl	CH(OH)Me
1 - 523	Br	CH(OH)Me
1 - 524	SMe	CH(OH)Me
1 - 525	CF ₃	CH(OH)Me
1 - 526	CN	CH(OH)Me
1 - 527	H	CH(OH)Et
1 - 528	Me	CH(OH)Et
1 - 529	Et	CH(OH)Et
1 - 530	n - Pr	CH(OH)Et
1 - 531	F	CH(OH)Et
1 - 532	Cl	CH(OH)Et
1 - 533	Br	CH(OH)Et
1 - 534	SMe	CH(OH)Et
1 - 535	CF ₃	CH(OH)Et
1 - 536	CN	CH(OH)Et
1 - 537	H	CH(OH)CF ₃
1 - 538	Me	CH(OH)CF ₃
1 - 539	Et	CH(OH)CF ₃
1 - 540	n - Pr	CH(OH)CF ₃
1 - 541	F	CH(OH)CF ₃
1 - 542	Cl	CH(OH)CF ₃
1 - 543	Br	CH(OH)CF ₃
1 - 544	SMe	CH(OH)CF ₃
1 - 545	CF ₃	CH(OH)CF ₃
1 - 546	CN	CH(OH)CF ₃
1 - 547	H	CH ₂ OMe

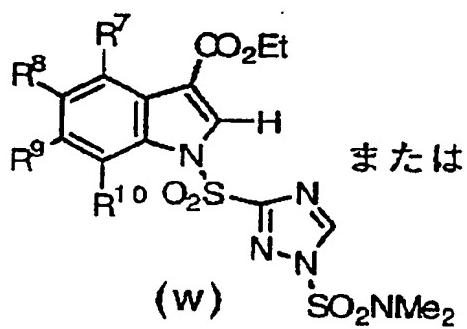
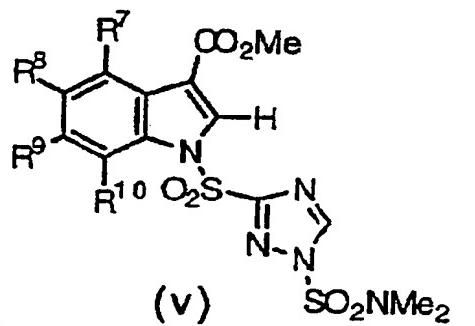
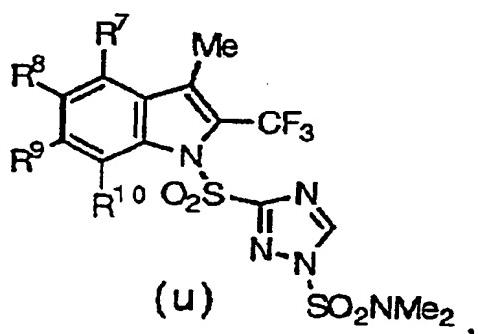
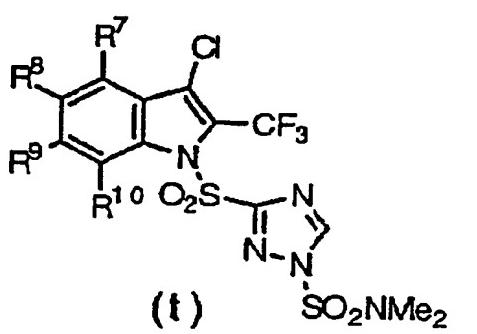
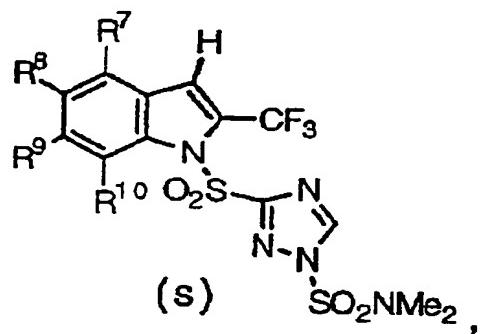
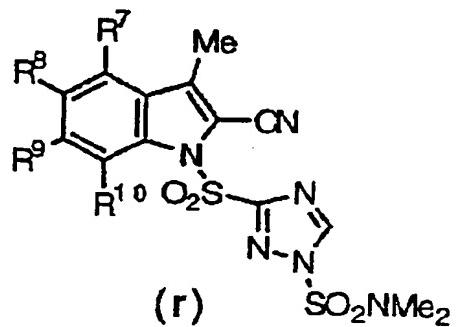
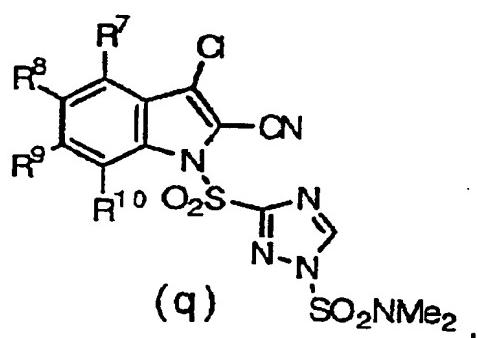
第 1 表 (続 き)

化合物 N o	R ³	R ⁴
1 - 548	Me	CH ₂ OMe
1 - 549	Et	CH ₂ OMe
1 - 550	n - Pr	CH ₂ OMe
1 - 551	F	CH ₂ OMe
1 - 552	Cl	CH ₂ OMe
1 - 553	Br	CH ₂ OMe
1 - 554	SMe	CH ₂ OMe
1 - 555	CF ₃	CH ₂ OMe
1 - 556	CN	CH ₂ OMe
1 - 557	H	CONMe ₂
1 - 558	Me	CONMe ₂
1 - 559	Et	CONMe ₂
1 - 560	n - Pr	CONMe ₂
1 - 561	F	CONMe ₂
1 - 562	Cl	CONMe ₂
1 - 563	Br	CONMe ₂
1 - 564	SMe	CONMe ₂
1 - 565	CF ₃	CONMe ₂
1 - 566	CN	CONMe ₂
1 - 567	H	CO(4 - CF ₃ Ph)
1 - 568	Me	CO(4 - CF ₃ Ph)
1 - 569	Et	CO(4 - CF ₃ Ph)
1 - 570	Cl	CO(4 - CF ₃ Ph)
1 - 571	Br	CO(4 - CF ₃ Ph)

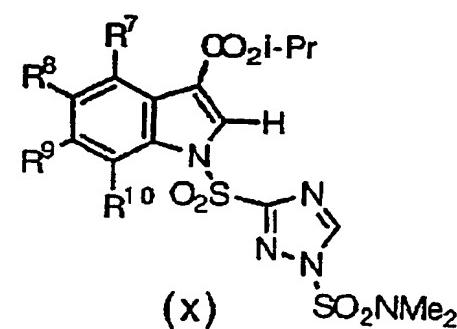
第 2 表





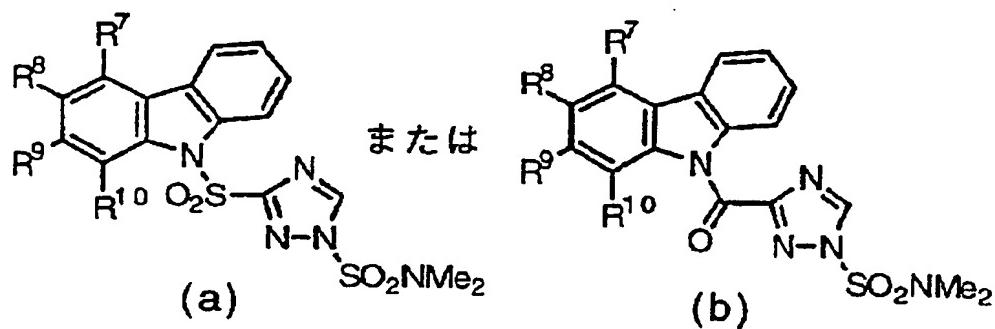


または



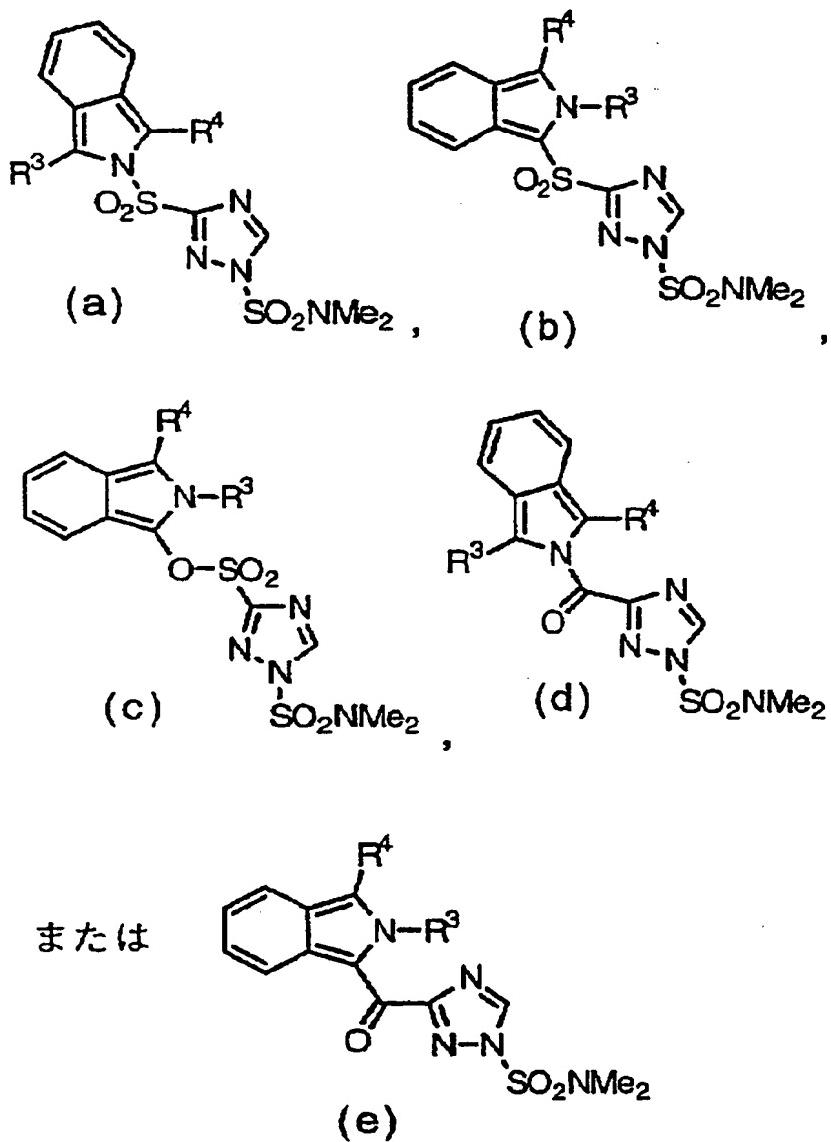
化合物No	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰
2 - 1	F	H	H	H
2 - 2	H	F	H	H
2 - 3	H	H	F	H
2 - 4	H	H	H	F
2 - 5	Cl	H	H	H
2 - 6	H	Cl	H	H
2 - 7	H	H	Cl	H
2 - 8	H	H	H	Cl
2 - 9	Br	H	H	H
2 - 10	H	Br	H	H
2 - 11	H	H	Br	H
2 - 12	H	H	H	Br
2 - 13	I	H	H	H
2 - 14	H	I	H	H
2 - 15	H	H	I	H
2 - 16	H	H	H	I
2 - 17	Me	H	H	H
2 - 18	H	Me	H	H
2 - 19	H	H	Me	H
2 - 20	H	H	H	Me
2 - 21	Et	H	H	H
2 - 22	H	Et	H	H
2 - 23	H	H	Et	H
2 - 24	H	H	H	Et
2 - 25	MeO	H	H	H
2 - 26	H	MeO	H	H
2 - 27	H	H	MeO	H
2 - 28	H	H	H	MeO
2 - 29	NO ₂	H	H	H
2 - 30	H	NO ₂	H	H
2 - 31	H	H	NO ₂	H
2 - 32	H	H	H	NO ₂
2 - 33	CN	H	H	H
2 - 34	H	CN	H	H
2 - 35	H	H	CN	H
2 - 36	H	H	H	CN
2 - 37	CF ₃	H	H	H
2 - 38	H	CF ₃	H	H
2 - 39	H	H	CF ₃	H
2 - 40	H	H	H	CF ₃
2 - 41	CO ₂ Me	H	H	H
2 - 42	H	CO ₂ Me	H	H
2 - 43	H	H	CO ₂ Me	H
2 - 44	H	H	H	CO ₂ Me

第 3 表



化合物No	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰
3-1	H	H	H	H
3-2	F	H	H	H
3-3	H	F	H	H
3-4	H	H	F	H
3-5	H	H	H	F
3-6	Cl	H	H	H
3-7	H	Cl	H	H
3-8	H	H	Cl	H
3-9	H	H	H	Cl
3-10	Br	H	H	H
3-11	H	Br	H	H
3-12	H	H	Br	H
3-13	H	H	H	Br
3-14	Me	H	H	H
3-15	H	Me	H	H
3-16	H	H	Me	H
3-17	H	H	H	Me
3-18	CF ₃	H	H	H
3-19	H	CF ₃	H	H
3-20	H	H	CF ₃	H
3-21	H	H	H	CF ₃

第 4 表

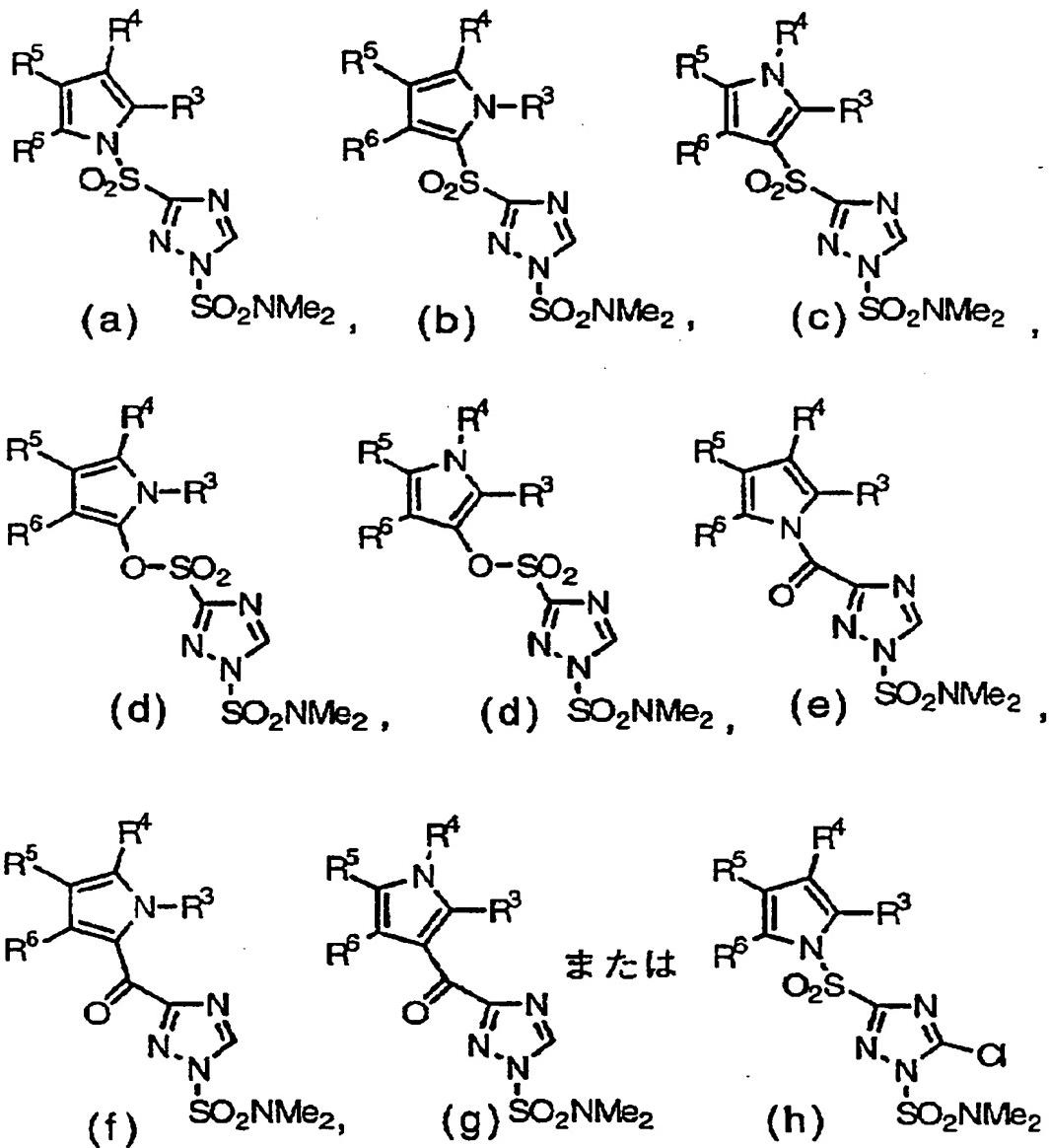


化合物 No	R^3	R^4
4 - 1	H	H
4 - 2	H	Me
4 - 3	H	Et
4 - 4	H	Cl
4 - 5	H	Br
4 - 6	H	CF_3

第 4 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴
4 - 7	Me	H
4 - 8	Me	Me
4 - 9	Me	Et
4 - 10	Me	Cl
4 - 11	Me	Br
4 - 12	Me	CF ₃
4 - 13	Et	H
4 - 14	Et	Me
4 - 15	Et	Et
4 - 16	Et	Cl
4 - 17	Et	Br
4 - 18	Et	CF ₃
4 - 19	Cl	H
4 - 20	Cl	Me
4 - 21	Cl	Et
4 - 22	Cl	Cl
4 - 23	Cl	Br
4 - 24	Cl	CF ₃
4 - 25	Br	H
4 - 26	Br	Me
4 - 27	Br	Et
4 - 28	Br	Br
4 - 29	Br	CF ₃

第 5 表



化合物No	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
5 - 1	H	Ph	H	H
5 - 2	Cl	Ph	H	H
5 - 3	H	Ph	Cl	H
5 - 4	H	Ph	H	Cl
5 - 5	Cl	Ph	Cl	H
5 - 6	Cl	Ph	H	Cl
5 - 7	H	Ph	Cl	Cl
5 - 8	Cl	Ph	Cl	Cl
5 - 9	Br	Ph	Cl	H
5 - 10	Cl	Ph	Br	H
5 - 11	Br	Ph	H	Cl
5 - 12	Cl	Ph	H	Br
5 - 13	H	Ph	Br	Cl
5 - 14	H	Ph	Cl	Br
5 - 15	Br	Ph	Cl	Cl
5 - 16	Cl	Ph	Br	Cl
5 - 17	Cl	Ph	Cl	Br
5 - 18	Br	Ph	Br	Cl
5 - 19	Br	Ph	Cl	Br
5 - 20	Cl	Ph	Br	Br
5 - 21	Me	Ph	H	H
5 - 22	H	Ph	Me	H
5 - 23	H	Ph	H	Me
5 - 24	Me	Ph	Cl	H
5 - 25	Me	Ph	H	Cl
5 - 26	Me	Ph	Cl	Cl
5 - 27	Me	Ph	Br	Cl
5 - 28	Me	Ph	Cl	Br
5 - 29	Cl	Ph	Me	H
5 - 30	H	Ph	Me	Cl
5 - 31	Cl	Ph	Me	Cl
5 - 32	Br	Ph	Me	Cl
5 - 33	Cl	Ph	Me	Br
5 - 34	Cl	Ph	H	Me
5 - 35	H	Ph	Cl	Me
5 - 36	Cl	Ph	Cl	Me
5 - 37	Br	Ph	Cl	Me
5 - 38	Cl	Ph	Br	Me
5 - 39	Br	Ph	H	H
5 - 40	H	Ph	Br	H
5 - 41	H	Ph	H	Br
5 - 42	Br	Ph	Br	H
5 - 43	Br	Ph	H	Br
5 - 44	H	Ph	Br	Br
5 - 45	Br	Ph	Br	Br
5 - 46	Me	Ph	Br	H

第 5 表 (続 き)

化合物No	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d
5 - 47	Me	Ph	H	Br
5 - 48	Me	Ph	Br	Br
5 - 49	Br	Ph	Me	H
5 - 50	H	Ph	Me	Br
5 - 51	Br	Ph	Me	Br
5 - 52	Br	Ph	H	Me
5 - 53	H	Ph	Br	Me
5 - 54	Br	Ph	Br	Me
5 - 55	Me	Ph	Me	H
5 - 56	Me	Ph	Me	Cl
5 - 57	Me	Ph	Me	Br
5 - 58	H	Ph	Me	Me
5 - 59	Cl	Ph	Me	Me
5 - 60	Br	Ph	Me	Me
5 - 61	Me	Ph	H	Me
5 - 62	Me	Ph	Cl	Me
5 - 63	Me	Ph	Br	Me
5 - 64	CO ₂ Me	Ph	Me	H
5 - 65	Me	Ph	CO ₂ Me	H
5 - 66	CO ₂ Me	Ph	Me	Cl
5 - 67	Me	Ph	CO ₂ Me	Cl
5 - 68	CO ₂ Me	Ph	Me	Br
5 - 69	Me	Ph	CO ₂ Me	Br
5 - 70	Ac	Ph	Me	H
5 - 71	Me	Ph	Ac	H
5 - 72	Ac	Ph	Me	Cl
5 - 73	Me	Ph	Ac	Cl
5 - 74	Ac	Ph	Me	Br
5 - 75	Me	Ph	Ac	Br
5 - 76	CN	Ph	Me	H
5 - 77	Me	Ph	CN	H
5 - 78	CN	Ph	Me	Cl
5 - 79	Me	Ph	CN	Cl
5 - 80	CN	Ph	Me	Br
5 - 81	Me	Ph	CN	Br
5 - 82	H	Ph	CO ₂ Me	Me
5 - 83	H	Ph	Me	CO ₂ Me
5 - 84	Cl	Ph	CO ₂ Me	Me
5 - 85	Cl	Ph	Me	CO ₂ Me
5 - 86	Br	Ph	CO ₂ Me	Me
5 - 87	Br	Ph	Me	CO ₂ Me
5 - 88	H	Ph	Ac	Me
5 - 89	H	Ph	Me	Ac
5 - 90	Cl	Ph	Ac	Me

第 5 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
5 - 91	Cl	Ph	Me	Ac
5 - 92	Br	Ph	Ac	Me
5 - 93	Br	Ph	Me	Ac
5 - 94	H	Ph	CN	Me
5 - 95	H	Ph	Me	CN
5 - 96	Cl	Ph	CN	Me
5 - 97	Cl	Ph	Me	CN
5 - 98	Br	Ph	CN	Me
5 - 99	Br	Ph	Me	CN
5 - 100	CO ₂ Me	Ph	H	Me
5 - 101	Me	Ph	H	CO ₂ Me
5 - 102	CO ₂ Me	Ph	Cl	Me
5 - 103	Me	Ph	Cl	CO ₂ Me
5 - 104	CO ₂ Me	Ph	Br	Me
5 - 105	Me	Ph	Br	CO ₂ Me
5 - 106	Ac	Ph	H	Me
5 - 107	Me	Ph	H	Ac
5 - 108	Ac	Ph	Cl	Me
5 - 109	Me	Ph	Cl	Ac
5 - 110	Ac	Ph	Br	Me
5 - 111	Me	Ph	Br	Ac
5 - 112	CN	Ph	H	Me
5 - 113	Me	Ph	H	CN
5 - 114	CN	Ph	Cl	Me
5 - 115	Me	Ph	Cl	CN
5 - 116	CN	Ph	Br	Me
5 - 117	Me	Ph	Br	CN
5 - 118	Et	Ph	H	H
5 - 119	H	Ph	Et	H
5 - 120	H	Ph	H	Et
5 - 121	Et	Ph	Cl	H
5 - 122	Et	Ph	H	Cl
5 - 123	Et	Ph	Cl	Cl
5 - 124	Et	Ph	Br	Cl
5 - 125	Et	Ph	Cl	Br
5 - 126	Cl	Ph	Et	H
5 - 127	H	Ph	Et	Cl
5 - 128	Cl	Ph	Et	Cl
5 - 129	Br	Ph	Et	Cl
5 - 130	Cl	Ph	Et	Br
5 - 131	Cl	Ph	H	Et
5 - 132	H	Ph	Cl	Et
5 - 133	Cl	Ph	Cl	Et
5 - 134	Br	Ph	Cl	Et

第 5 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
5 - 135	Cl	Ph	Br	Et
5 - 136	Et	Ph	Br	H
5 - 137	Et	Ph	H	Br
5 - 138	Et	Ph	Br	Br
5 - 139	Br	Ph	Et	H
5 - 140	H	Ph	Et	Br
5 - 141	Br	Ph	Et	Br
5 - 142	Br	Ph	H	Et
5 - 143	H	Ph	Br	Et
5 - 144	Br	Ph	Br	Et
5 - 145	CN	Ph	H	H
5 - 146	H	Ph	CN	H
5 - 147	H	Ph	H	CN
5 - 148	CN	Ph	C1	H
5 - 149	CN	Ph	H	C1
5 - 150	CN	Ph	C1	C1
5 - 151	CN	Ph	Br	C1
5 - 152	CN	Ph	C1	Br
5 - 153	C1	Ph	CN	H
5 - 154	H	Ph	CN	C1
5 - 155	C1	Ph	CN	C1
5 - 156	Br	Ph	CN	C1
5 - 157	C1	Ph	CN	Br
5 - 158	C1	Ph	H	CN
5 - 159	H	Ph	C1	CN
5 - 160	Br	Ph	H	CN
5 - 161	H	Ph	Br	CN
5 - 162	CN	Ph	Br	H
5 - 163	CN	Ph	H	Br
5 - 164	CN	Ph	Br	Br
5 - 165	Br	Ph	CN	H
5 - 166	H	Ph	CN	Br
5 - 167	Br	Ph	CN	Br
5 - 168	C1	Ph	C1	CN
5 - 169	C1	Ph	Br	CN
5 - 170	Br	Ph	C1	CN
5 - 171	Br	Ph	Br	CN
5 - 172	CF ₃	Ph	H	H
5 - 173	H	Ph	CF ₃	H
5 - 174	H	Ph	H	CF ₃
5 - 175	CF ₃	Ph	C1	H
5 - 176	CF ₃	Ph	H	C1
5 - 177	CF ₃	Ph	C1	C1
5 - 178	CF ₃	Ph	Br	C1

第 5 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
5 - 179	CF ₃	Ph	Cl	Br
5 - 180	Cl	Ph	CF ₃	H
5 - 181	H	Ph	CF ₃	Cl
5 - 182	Cl	Ph	CF ₃	Cl
5 - 183	Br	Ph	CF ₃	Cl
5 - 184	Cl	Ph	CF ₃	Br
5 - 185	Cl	Ph	H	CF ₃
5 - 186	H	Ph	Cl	CF ₃
5 - 187	Cl	Ph	Cl	CF ₃
5 - 188	Br	Ph	Cl	CF ₃
5 - 189	Cl	Ph	Br	CF ₃
5 - 190	CF ₃	Ph	Br	H
5 - 191	CF ₃	Ph	H	Br
5 - 192	CF ₃	Ph	Br	Br
5 - 193	Br	Ph	CF ₃	H
5 - 194	H	Ph	CF ₃	Br
5 - 195	Br	Ph	CF ₃	Br
5 - 196	Br	Ph	H	CF ₃
5 - 197	H	Ph	Br	CF ₃
5 - 198	Br	Ph	Br	CF ₃
5 - 199	NO ₂	Ph	H	H
5 - 200	H	Ph	NO ₂	H
5 - 201	H	Ph	H	NO ₂
5 - 202	NO ₂	Ph	Cl	H
5 - 203	NO ₂	Ph	H	Cl
5 - 204	NO ₂	Ph	Cl	Cl
5 - 205	NO ₂	Ph	Br	Cl
5 - 206	NO ₂	Ph	Cl	Br
5 - 207	Cl	Ph	NO ₂	H
5 - 208	H	Ph	NO ₂	Cl
5 - 209	Cl	Ph	NO ₂	Cl
5 - 210	Br	Ph	NO ₂	Cl
5 - 211	Cl	Ph	NO ₂	Br
5 - 212	Cl	Ph	H	NO ₂
5 - 213	H	Ph	Cl	NO ₂
5 - 214	Cl	Ph	Cl	NO ₂
5 - 215	Br	Ph	Cl	NO ₂
5 - 216	Cl	Ph	Br	NO ₂
5 - 217	NO ₂	Ph	Br	H
5 - 218	NO ₂	Ph	H	Br
5 - 219	NO ₂	Ph	Br	Br
5 - 220	Br	Ph	NO ₂	H
5 - 221	H	Ph	NO ₂	Br
5 - 222	Br	Ph	NO ₂	Br

第 5 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
5 - 223	Br	Ph	H	NO ₂
5 - 224	H	Ph	Br	NO ₂
5 - 225	Br	Ph	Br	NO ₂
5 - 226	CO ₂ Me	Ph	H	H
5 - 227	H	Ph	CO ₂ Me	H
5 - 228	H	Ph	H	CO ₂ Me
5 - 229	CO ₂ Me	Ph	Cl	H
5 - 230	CO ₂ Me	Ph	H	Cl
5 - 231	CO ₂ Me	Ph	Cl	Cl
5 - 232	CO ₂ Me	Ph	Br	Cl
5 - 233	CO ₂ Me	Ph	Cl	Br
5 - 234	Cl	Ph	CO ₂ Me	H
5 - 235	H	Ph	CO ₂ Me	Cl
5 - 236	Cl	Ph	CO ₂ Me	Cl
5 - 237	Br	Ph	CO ₂ Me	Cl
5 - 238	Cl	Ph	CO ₂ Me	Br
5 - 239	Cl	Ph	H	CO ₂ Me
5 - 240	H	Ph	Cl	CO ₂ Me
5 - 241	Cl	Ph	Cl	CO ₂ Me
5 - 242	Br	Ph	Cl	CO ₂ Me
5 - 243	Cl	Ph	Br	CO ₂ Me
5 - 244	CO ₂ Me	Ph	Br	H
5 - 245	CO ₂ Me	Ph	H	Br
5 - 246	CO ₂ Me	Ph	Br	Br
5 - 247	Br	Ph	CO ₂ Me	H
5 - 248	H	Ph	CO ₂ Me	Br
5 - 249	Br	Ph	CO ₂ Me	Br
5 - 250	Br	Ph	H	CO ₂ Me
5 - 251	H	Ph	Br	CO ₂ Me
5 - 252	Br	Ph	Br	CO ₂ Me
5 - 253	Ac	Ph	H	H
5 - 254	H	Ph	Ac	H
5 - 255	H	Ph	H	Ac
5 - 256	Ac	Ph	Cl	H
5 - 257	Ac	Ph	H	Cl
5 - 258	Ac	Ph	Cl	Cl
5 - 259	Ac	Ph	Br	Cl
5 - 260	Ac	Ph	Cl	Br
5 - 261	Cl	Ph	Ac	H
5 - 262	H	Ph	Ac	Cl
5 - 263	Cl	Ph	Ac	Cl
5 - 264	Br	Ph	Ac	Cl
5 - 265	Cl	Ph	Ac	Br
5 - 266	Cl	Ph	H	Ac

第 5 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
5 - 267	H	Ph	C1	Ac
5 - 268	Cl	Ph	Cl	Ac
5 - 269	Br	Ph	Cl	Ac
5 - 270	Cl	Ph	Br	Ac
5 - 271	Ac	Ph	Br	H
5 - 272	Ac	Ph	H	Br
5 - 273	Ac	Ph	Br	Br
5 - 274	Br	Ph	Ac	H
5 - 275	H	Ph	Ac	Br
5 - 276	Br	Ph	Ac	Br
5 - 277	Br	Ph	H	Ac
5 - 278	H	Ph	Br	Ac
5 - 279	Br	Ph	Br	Ac
5 - 280	Ph	H	H	H
5 - 281	Ph	C1	H	H
5 - 282	Ph	H	C1	H
5 - 283	Ph	H	H	C1
5 - 284	Ph	C1	C1	H
5 - 285	Ph	Br	C1	H
5 - 286	Ph	C1	Br	H
5 - 287	Ph	C1	H	C1
5 - 288	Ph	Br	H	C1
5 - 289	Ph	C1	H	Br
5 - 290	Ph	H	C1	C1
5 - 291	Ph	H	Br	C1
5 - 292	Ph	H	C1	Br
5 - 293	Ph	C1	C1	C1
5 - 294	Ph	Br	C1	C1
5 - 295	Ph	C1	Br	C1
5 - 296	Ph	C1	C1	Br
5 - 297	Ph	Br	Br	C1
5 - 298	Ph	Br	C1	Br
5 - 299	Ph	C1	Br	Br
5 - 300	Ph	Me	H	H
5 - 301	Ph	H	Me	H
5 - 302	Ph	H	H	Me
5 - 303	Ph	Me	C1	H
5 - 304	Ph	Me	H	C1
5 - 305	Ph	Me	C1	C1
5 - 306	Ph	Me	Br	C1
5 - 307	Ph	Me	C1	Br
5 - 308	Ph	C1	Me	H
5 - 309	Ph	H	Me	C1
5 - 310	Ph	C1	Me	C1

第 5 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
5 - 311	Ph	Cl	Me	Br
5 - 312	Ph	Cl	H	Me
5 - 313	Ph	H	Cl	Me
5 - 314	Ph	Cl	Cl	Me
5 - 315	Ph	Br	H	H
5 - 316	Ph	H	Br	H
5 - 317	Ph	H	H	Br
5 - 318	Ph	Br	Br	H
5 - 319	Ph	Br	H	Br
5 - 320	Ph	H	Br	Br
5 - 321	Ph	Br	Br	Br
5 - 322	Ph	Me	Br	H
5 - 323	Ph	Me	H	Br
5 - 324	Ph	Me	Br	Br
5 - 325	Ph	Br	Me	H
5 - 326	Ph	H	Me	Br
5 - 327	Ph	Br	Me	Br
5 - 328	Ph	Br	Me	Cl
5 - 329	Ph	Br	H	Me
5 - 330	Ph	H	Br	Me
5 - 331	Ph	Br	Br	Me
5 - 332	Ph	CN	H	H
5 - 333	Ph	H	CN	H
5 - 334	Ph	H	H	CN
5 - 335	Ph	CN	Cl	H
5 - 336	Ph	CN	H	Cl
5 - 337	Ph	CN	Cl	Cl
5 - 338	Ph	CN	Br	Cl
5 - 339	Ph	CN	Cl	Br
5 - 340	Ph	Cl	CN	H
5 - 341	Ph	H	CN	Cl
5 - 342	Ph	Cl	CN	Cl
5 - 343	Ph	Br	CN	Cl
5 - 344	Ph	Cl	CN	Br
5 - 345	Ph	Cl	H	CN
5 - 346	Ph	H	Cl	CN
5 - 347	Ph	Cl	Cl	CN
5 - 348	Ph	Br	Cl	CN
5 - 349	Ph	Cl	Br	CN
5 - 350	Ph	CN	Br	H
5 - 351	Ph	CN	H	Br
5 - 352	Ph	CN	Br	Br
5 - 353	Ph	Br	CN	H
5 - 354	Ph	H	CN	Br

第 5 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
5 - 355	Ph	Br	CN	Br
5 - 356	Ph	Br	H	CN
5 - 357	Ph	H	Br	CN
5 - 358	Ph	Br	Br	CN
5 - 359	Ph	CF ₃	H	H
5 - 360	Ph	H	CF ₃	H
5 - 361	Ph	H	H	CF ₃
5 - 362	Ph	CF ₃	Cl	H
5 - 363	Ph	CF ₃	H	Cl
5 - 364	Ph	CF ₃	Cl	Cl
5 - 365	Ph	CF ₃	Br	Cl
5 - 366	Ph	CF ₃	Cl	Br
5 - 367	Ph	Cl	CF ₃	H
5 - 368	Ph	H	CF ₃	Cl
5 - 369	Ph	Cl	CF ₃	Cl
5 - 370	Ph	Br	CF ₃	Cl
5 - 371	Ph	Cl	CF ₃	Br
5 - 372	Ph	Cl	H	CF ₃
5 - 373	Ph	H	Cl	CF ₃
5 - 374	Ph	Cl	Cl	CF ₃
5 - 375	Ph	Br	Cl	CF ₃
5 - 376	Ph	Cl	Br	CF ₃
5 - 377	Ph	CF ₃	Br	H
5 - 378	Ph	CF ₃	H	Br
5 - 379	Ph	CF ₃	Br	Br
5 - 380	Ph	Br	CF ₃	H
5 - 381	Ph	H	CF ₃	Br
5 - 382	Ph	Br	CF ₃	Br
5 - 383	Ph	Br	H	CF ₃
5 - 384	Ph	H	Br	CF ₃
5 - 385	Ph	Br	Br	CF ₃
5 - 386	Ph	NO ₂	H	H
5 - 387	Ph	H	NO ₂	H
5 - 388	Ph	H	H	NO ₂
5 - 389	Ph	NO ₂	Cl	H
5 - 390	Ph	NO ₂	H	Cl
5 - 391	Ph	NO ₂	Cl	Cl
5 - 392	Ph	NO ₂	Br	Cl
5 - 393	Ph	NO ₂	Cl	Br
5 - 394	Ph	Cl	NO ₂	H
5 - 395	Ph	H	NO ₂	Cl
5 - 396	Ph	Cl	NO ₂	Cl
5 - 397	Ph	Br	NO ₂	Cl
5 - 398	Ph	Cl	NO ₂	Br

第 5 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
5 - 399	Ph	NO ₂	Br	H
5 - 400	Ph	NO ₂	H	Br
5 - 401	Ph	NO ₂	Br	Br
5 - 402	Ph	Br	NO ₂	H
5 - 403	Ph	H	NO ₂	Br
5 - 404	Ph	Br	NO ₂	Br
5 - 405	Ph	CO ₂ Me	H	H
5 - 406	Ph	H	CO ₂ Me	H
5 - 407	Ph	H	H	CO ₂ Me
5 - 408	Ph	CO ₂ Me	Cl	H
5 - 409	Ph	CO ₂ Me	H	Cl
5 - 410	Ph	CO ₂ Me	Cl	Cl
5 - 411	Ph	CO ₂ Me	Br	Cl
5 - 412	Ph	CO ₂ Me	Cl	Br
5 - 413	Ph	Cl	CO ₂ Me	H
5 - 414	Ph	H	CO ₂ Me	Cl
5 - 415	Ph	Cl	CO ₂ Me	Cl
5 - 416	Ph	Br	CO ₂ Me	Cl
5 - 417	Ph	Cl	CO ₂ Me	Br
5 - 418	Ph	Cl	H	CO ₂ Me
5 - 419	Ph	H	Cl	CO ₂ Me
5 - 420	Ph	Cl	Cl	CO ₂ Me
5 - 421	Ph	Br	Cl	CO ₂ Me
5 - 422	Ph	Cl	Br	CO ₂ Me
5 - 423	Ph	Cl	Br	Me
5 - 424	Ph	Br	Cl	Me
5 - 425	Ph	CO ₂ Me	Br	H
5 - 426	Ph	CO ₂ Me	H	Br
5 - 427	Ph	CO ₂ Me	Br	Br
5 - 428	Ph	Br	CO ₂ Me	H
5 - 429	Ph	H	CO ₂ Me	Br
5 - 430	Ph	Br	CO ₂ Me	Br
5 - 431	Ph	Br	H	CO ₂ Me
5 - 432	Ph	H	Br	CO ₂ Me
5 - 433	Ph	Br	Br	CO ₂ Me
5 - 434	Ph	CO ₂ Et	Cl	H
5 - 435	Ph	CO ₂ Et	H	Cl
5 - 436	Ph	CO ₂ Et	Cl	Cl
5 - 437	Ph	CO ₂ Et	Br	Cl
5 - 438	Ph	CO ₂ Et	Cl	Br
5 - 439	Ph	CO ₂ Et	Br	Br
5 - 440	Ph	Cl	CO ₂ Et	H
5 - 441	Ph	H	CO ₂ Et	Cl
5 - 442	Ph	Cl	CO ₂ Et	Cl

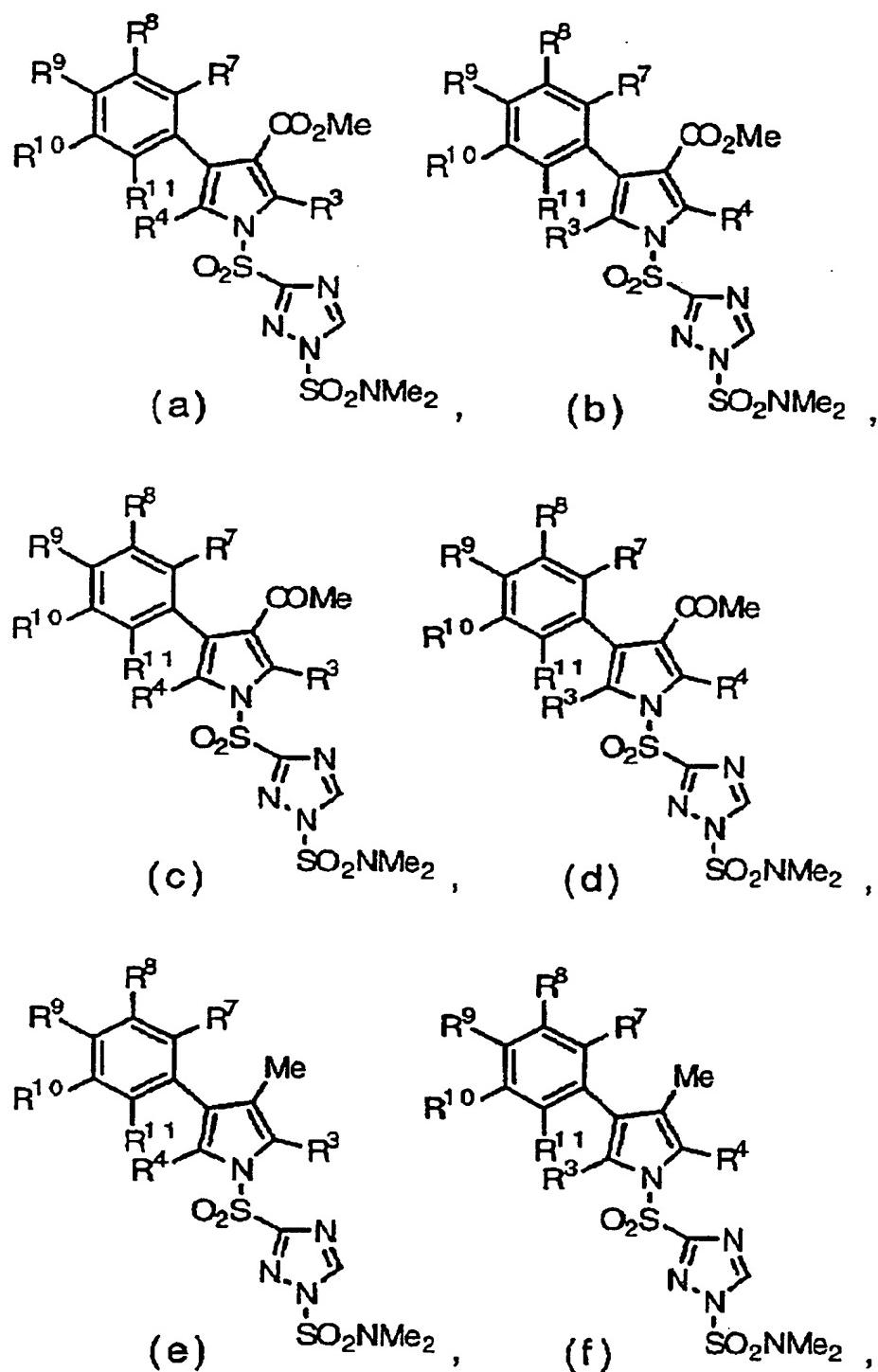
第 5 表 (続 き)

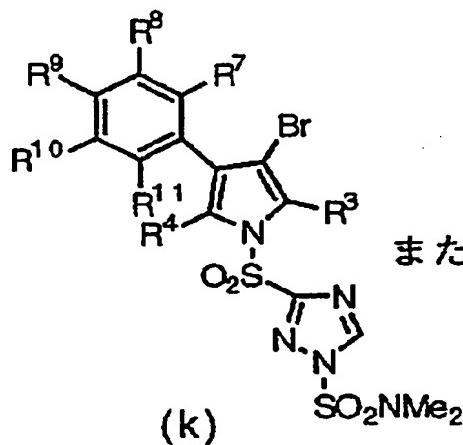
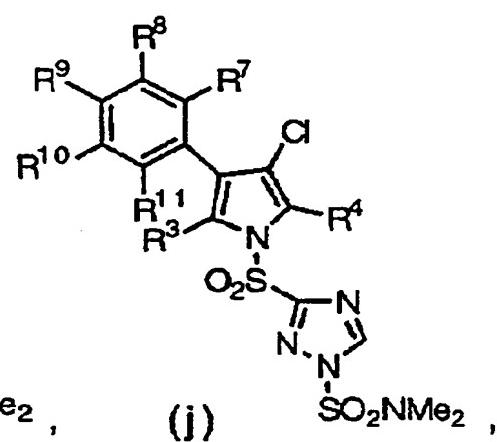
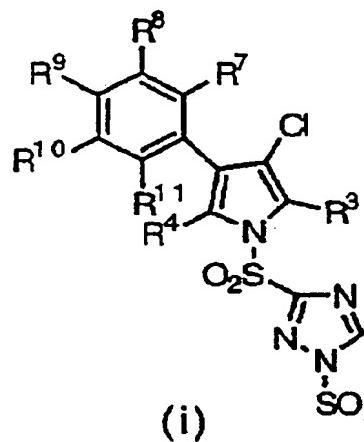
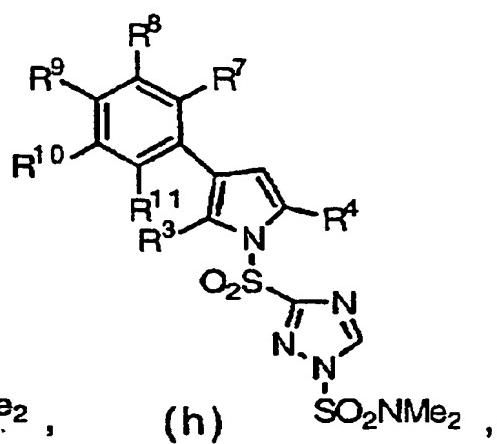
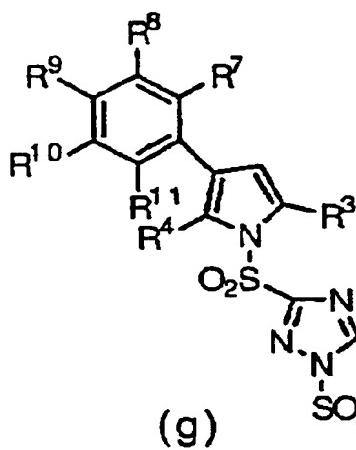
化合物No	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
5 - 443	Ph	Br	CO ₂ Et	Cl
5 - 444	Ph	Cl	CO ₂ Et	Br
5 - 445	Ph	Br	CO ₂ Et	Br
5 - 446	Ph	H	H	CO ₂ Et
5 - 447	Ph	Cl	H	CO ₂ Et
5 - 448	Ph	H	Cl	CO ₂ Et
5 - 449	Ph	Cl	Cl	CO ₂ Et
5 - 450	Ph	Cl	Br	CO ₂ Et
5 - 451	Ph	Br	Cl	CO ₂ Et
5 - 452	Ph	Br	Br	CO ₂ Et
5 - 453	Ph	H	H	Ac
5 - 454	Ph	Cl	H	Ac
5 - 455	Ph	H	Cl	Ac
5 - 456	Ph	Cl	Cl	Ac
5 - 457	Ph	H	H	Et
5 - 458	Ph	Cl	H	Et
5 - 459	Ph	H	Cl	Et
5 - 460	Ph	Cl	Cl	Et
5 - 461	Ph	H	H	Ph
5 - 462	Ph	Cl	H	Ph
5 - 463	Ph	H	Cl	Ph
5 - 464	Ph	Cl	Cl	Ph
5 - 465	Ph	Ph	H	H
5 - 466	H	Ph	Ph	H
5 - 467	H	Ph	H	Ph
5 - 468	Ph	Ph	Cl	H
5 - 469	Ph	Ph	H	Cl
5 - 470	Ph	Ph	Cl	Cl
5 - 471	Ph	Ph	Br	Cl
5 - 472	Ph	Ph	Cl	Br
5 - 473	Ph	Ph	Br	H
5 - 474	Ph	Ph	H	Br
5 - 475	Ph	Ph	Br	Br
5 - 476	Cl	Ph	Ph	H
5 - 477	Cl	Ph	Ph	Cl
5 - 478	Br	Ph	Ph	H
5 - 479	Br	Ph	Ph	Cl
5 - 480	Br	Ph	Ph	Br
5 - 481	Cl	Ph	H	Ph
5 - 482	H	Ph	Cl	Ph
5 - 483	Br	Ph	H	Ph
5 - 484	H	Ph	Br	Ph
5 - 485	Cl	Ph	Cl	Ph
5 - 486	Br	Ph	Cl	Ph

第 5 表 (続 き)

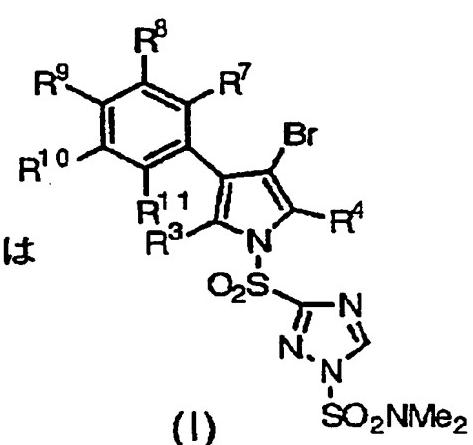
化合物No	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
5 - 487	Cl	Ph	Br	Ph
5 - 488	Br	Ph	Br	Ph
5 - 489	CO ₂ Et	Ph	H	H
5 - 490	H	Ph	CO ₂ Et	H
5 - 491	H	Ph	H	CO ₂ Et
5 - 492	CO ₂ Et	Ph	Cl	H
5 - 493	CO ₂ Et	Ph	H	Cl
5 - 494	CO ₂ Et	Ph	Cl	Cl
5 - 495	Cl	Ph	CO ₂ Et	H
5 - 496	H	Ph	CO ₂ Et	Cl
5 - 497	Cl	Ph	CO ₂ Et	Cl
5 - 498	Cl	Ph	H	CO ₂ Et
5 - 499	H	Ph	Cl	CO ₂ Et
5 - 500	Cl	Ph	Cl	CO ₂ Et
5 - 501	CO ₂ Et	Ph	Br	H
5 - 502	CO ₂ Et	Ph	H	Br
5 - 503	CO ₂ Et	Ph	Cl	Br
5 - 504	CO ₂ Et	Ph	Br	Cl
5 - 505	CO ₂ Et	Ph	Br	Br
5 - 506	Br	Ph	CO ₂ Et	H
5 - 507	H	Ph	CO ₂ Et	Br
5 - 508	Br	Ph	CO ₂ Et	Br
5 - 509	Cl	Ph	CO ₂ Et	Br
5 - 510	Br	Ph	CO ₂ Et	Cl
5 - 511	Br	Ph	H	CO ₂ Et
5 - 512	H	Ph	Br	CO ₂ Et
5 - 513	Br	Ph	Br	CO ₂ Et
5 - 514	Cl	Ph	Br	CO ₂ Et
5 - 515	Br	Ph	Cl	CO ₂ Et
5 - 516	H	Ph	CO ₂ Et	Me
5 - 517	Cl	Ph	CO ₂ Et	Me
5 - 518	Br	Ph	CO ₂ Et	Me
5 - 519	Me	Ph	CO ₂ Et	H
5 - 520	Me	Ph	CO ₂ Et	Cl
5 - 521	Me	Ph	CO ₂ Et	Br
5 - 522	Ph	H	H	NO ₂
5 - 523	Ph	Cl	H	NO ₂
5 - 524	Ph	H	Cl	NO ₂
5 - 525	Ph	Cl	Cl	NO ₂

第 6 表





または



化合物No	R ³	R ⁴	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
6 - 1	H	H	Me	H	H	H	H
6 - 2	H	H	H	Me	H	H	H
6 - 3	H	H	H	H	Me	H	H
6 - 4	H	H	Cl	H	H	H	H
6 - 5	H	H	H	Cl	H	H	H
6 - 6	H	H	H	H	Cl	H	H
6 - 7	H	H	Br	H	H	H	H
6 - 8	H	H	H	Br	H	H	H
6 - 9	H	H	H	H	Br	H	H
6 - 10	H	H	CF ₃	H	H	H	H
6 - 11	H	H	H	CF ₃	H	H	H
6 - 12	H	H	H	H	CF ₃	H	H
6 - 13	H	Cl	Me	H	H	H	H
6 - 14	H	Cl	H	Me	H	H	H
6 - 15	H	Cl	H	H	Me	H	H
6 - 16	H	Cl	Cl	H	H	H	H
6 - 17	H	Cl	H	Cl	H	H	H
6 - 18	H	Cl	H	H	Cl	H	H
6 - 19	H	Cl	Br	H	H	H	H
6 - 20	H	Cl	H	Br	H	H	H
6 - 21	H	Cl	H	H	Br	H	H
6 - 22	H	Cl	CF ₃	H	H	H	H
6 - 23	H	Cl	H	CF ₃	H	H	H
6 - 24	H	Cl	H	H	CF ₃	H	H
6 - 25	H	Br	Me	H	H	H	H
6 - 26	H	Br	H	Me	H	H	H
6 - 27	H	Br	H	H	Me	H	H
6 - 28	H	Br	Cl	H	H	H	H
6 - 29	H	Br	H	Cl	H	H	H
6 - 30	H	Br	H	H	Cl	H	H
6 - 31	H	Br	Br	H	H	H	H
6 - 32	H	Br	H	Br	H	H	H
6 - 33	H	Br	H	H	Br	H	H
6 - 34	H	Br	CF ₃	H	H	H	H
6 - 35	H	Br	H	CF ₃	H	H	H
6 - 36	H	Br	H	H	CF ₃	H	H
6 - 37	H	Me	Me	H	H	H	H
6 - 38	H	Me	Me	H	Me	H	H
6 - 39	H	Me	Me	H	H	Me	H
6 - 40	H	Me	Me	Cl	H	H	H
6 - 41	H	Me	Me	H	Cl	H	H
6 - 42	H	Me	Me	H	H	Cl	H
6 - 43	H	Me	Me	Br	H	H	H
6 - 44	H	Me	Me	H	Br	H	H
6 - 45	H	Me	Me	H	H	Br	H
6 - 46	H	Me	Me	CF ₃	H	H	H

第 6 表 (続 き)

化合物 N o	R ³	R ⁴	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
6 - 47	H	Me	H	CF ₃	H	H	H
6 - 48	H	Me	H	H	CF ₃	H	H
6 - 49	Me	Cl	Me	H	H	H	H
6 - 50	Me	Cl	H	Me	H	H	H
6 - 51	Me	Cl	H	H	Me	H	H
6 - 52	Me	Cl	Cl	H	H	H	H
6 - 53	Me	Cl	H	Cl	H	H	H
6 - 54	Me	Cl	H	H	Cl	H	H
6 - 55	Me	Cl	Br	H	H	H	H
6 - 56	Me	Cl	H	Br	H	H	H
6 - 57	Me	Cl	H	H	Br	H	H
6 - 58	Me	Cl	CF ₃	H	H	H	H
6 - 59	Me	Cl	H	CF ₃	H	H	H
6 - 60	Me	Cl	H	H	CF ₃	H	H
6 - 61	Me	Br	Me	H	H	H	H
6 - 62	Me	Br	H	Me	H	H	H
6 - 63	Me	Br	H	H	Me	H	H
6 - 64	Me	Br	Cl	H	H	H	H
6 - 65	Me	Br	H	Cl	H	H	H
6 - 66	Me	Br	H	H	Cl	H	H
6 - 67	Me	Br	Br	H	H	H	H
6 - 68	Me	Br	H	Br	H	H	H
6 - 69	Me	Br	H	H	Br	H	H
6 - 70	Me	Br	CF ₃	H	H	H	H
6 - 71	Me	Br	H	CF ₃	H	H	H
6 - 72	Me	Br	H	H	CF ₃	H	H
6 - 73	Cl	Cl	Me	H	H	H	H
6 - 74	Cl	Cl	H	Me	H	H	H
6 - 75	Cl	Cl	H	H	Me	H	H
6 - 76	Cl	Cl	Cl	H	H	H	H
6 - 77	Cl	Cl	H	Cl	H	H	H
6 - 78	Cl	Cl	H	H	Cl	H	H
6 - 79	Cl	Cl	Br	H	H	H	H
6 - 80	Cl	Cl	H	Br	H	H	H
6 - 81	Cl	Cl	H	H	Br	H	H
6 - 82	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H
6 - 83	Cl	Cl	H	CF ₃	H	H	H
6 - 84	Cl	Cl	H	H	CF ₃	H	H
6 - 85	Cl	Br	Me	H	H	H	H
6 - 86	Cl	Br	H	Me	H	H	H
6 - 87	Cl	Br	H	H	Me	H	H
6 - 88	Cl	Br	Cl	H	H	C1	H
6 - 89	Cl	Br	H	C1	H	H	H
6 - 90	Cl	Br	H	H	C1	H	H

第 6 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
6 - 91	C1	Br	Br	H	H	H	H
6 - 92	C1	Br	H	Br	H	H	H
6 - 93	C1	Br	H	H	Br	H	H
6 - 94	C1	Br	CF ₃	H	H	H	H
6 - 95	C1	Br	H	CF ₃	H	H	H
6 - 96	C1	Br	H	H	CF ₃	H	H
6 - 97	Br	Br	Me	H	H	H	H
6 - 98	Br	Br	H	Me	H	H	H
6 - 99	Br	Br	H	H	Me	H	H
6 - 100	Br	Br	C1	H	H	H	H
6 - 101	Br	Br	H	C1	H	H	H
6 - 102	Br	Br	H	H	C1	H	H
6 - 103	Br	Br	Br	H	H	H	H
6 - 104	Br	Br	H	Br	H	H	H
6 - 105	Br	Br	H	H	Br	H	H
6 - 106	Br	Br	CF ₃	H	H	H	H
6 - 107	Br	Br	H	CF ₃	H	H	H
6 - 108	Br	Br	H	H	CF ₃	H	H
6 - 109	Me	Me	Me	H	H	H	H
6 - 110	Me	Me	Me	H	Me	H	H
6 - 111	Me	Me	Me	H	Me	H	H
6 - 112	Me	Me	Me	C1	H	H	H
6 - 113	Me	Me	Me	H	C1	H	H
6 - 114	Me	Me	Me	H	H	C1	H
6 - 115	Me	Me	Me	Br	H	H	H
6 - 116	Me	Me	Me	H	Br	H	H
6 - 117	Me	Me	Me	H	H	Br	H
6 - 118	Me	Me	Me	CF ₃	H	H	H
6 - 119	Me	Me	Me	H	CF ₃	H	H
6 - 120	Me	Me	Me	H	H	CF ₃	H
6 - 121	H	H	H	Me	C1	H	H
6 - 122	H	H	H	Me	H	C1	H
6 - 123	H	H	H	Me	H	H	C1
6 - 124	H	H	H	Me	H	H	C1
6 - 125	H	H	H	C1	Me	H	H
6 - 126	H	H	H	H	Me	C1	H
6 - 127	H	H	H	H	Me	H	C1
6 - 128	H	H	H	H	Me	H	C1
6 - 129	H	H	H	C1	H	Me	H
6 - 130	H	H	H	H	C1	Me	H
6 - 131	H	H	H	C1	C1	H	H
6 - 132	H	H	H	C1	H	C1	H
6 - 133	H	H	H	C1	H	H	C1
6 - 134	H	H	H	C1	H	H	C1

第 6 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
6 - 135	H	H	H	C1	C1	H	H
6 - 136	H	H	H	C1	H	C1	H
6 - 137	H	H	CF ₃	C1	H	H	H
6 - 138	H	H	CF ₃	H	C1	H	H
6 - 139	H	H	CF ₃	H	H	C1	H
6 - 140	H	H	CF ₃	H	H	H	C1
6 - 141	H	H	C1	CF ₃	H	H	H
6 - 142	H	H	H	CF ₃	C1	H	H
6 - 143	H	H	H	CF ₃	H	C1	H
6 - 144	H	H	H	CF ₃	H	H	C1
6 - 145	H	H	C1	H	CF ₃	H	H
6 - 146	H	H	H	C1	CF ₃	H	H
6 - 147	H	C1	Me	C1	H	H	H
6 - 148	H	C1	Me	H	C1	H	H
6 - 149	H	C1	Me	H	H	C1	H
6 - 150	H	C1	Me	H	H	H	C1
6 - 151	H	C1	C1	Me	H	H	H
6 - 152	H	C1	H	Me	C1	H	H
6 - 153	H	C1	H	Me	H	C1	H
6 - 154	H	C1	H	Me	H	H	C1
6 - 155	H	C1	C1	H	Me	H	H
6 - 156	H	C1	H	C1	Me	H	H
6 - 157	H	C1	C1	C1	H	C1	H
6 - 158	H	C1	C1	H	C1	H	H
6 - 159	H	C1	C1	H	H	C1	H
6 - 160	H	C1	C1	H	H	H	C1
6 - 161	H	C1	H	C1	C1	H	H
6 - 162	H	C1	H	C1	H	C1	H
6 - 163	H	Br	Me	C1	H	C1	H
6 - 164	H	Br	Me	H	C1	H	H
6 - 165	H	Br	Me	H	H	C1	H
6 - 166	H	Br	Me	H	H	H	C1
6 - 167	H	Br	C1	Me	H	H	H
6 - 168	H	Br	H	Me	C1	H	H
6 - 169	H	Br	H	Me	H	C1	H
6 - 170	H	Br	H	Me	H	H	C1
6 - 171	H	Br	C1	H	Me	H	H
6 - 172	H	Br	H	C1	Me	H	H
6 - 173	H	Br	C1	C1	H	H	H
6 - 174	H	Br	C1	H	C1	H	H
6 - 175	H	Br	C1	H	H	C1	H
6 - 176	H	Br	C1	H	C1	H	C1
6 - 177	H	Br	H	C1	C1	H	H
6 - 178	H	Br	H	C1	H	C1	H

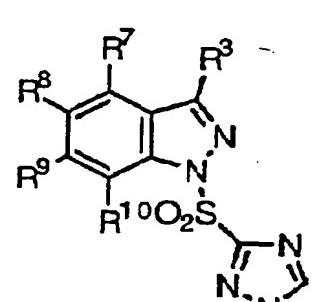
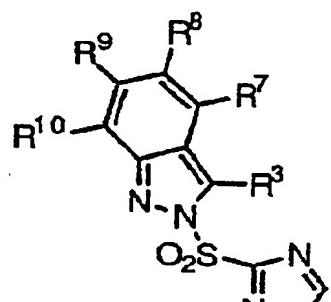
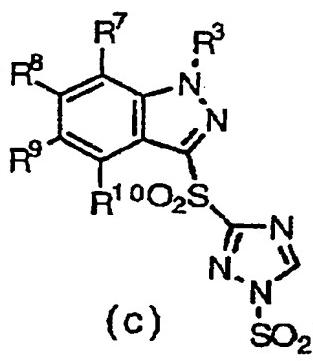
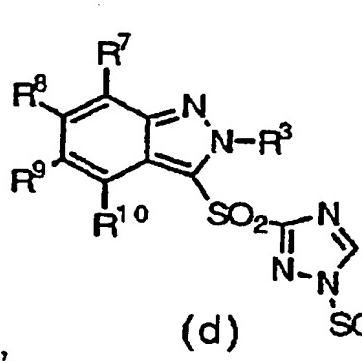
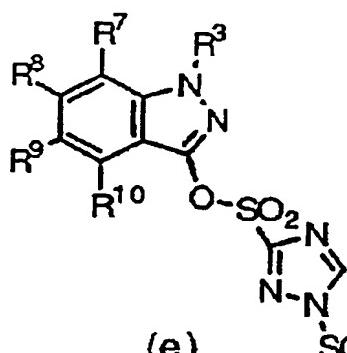
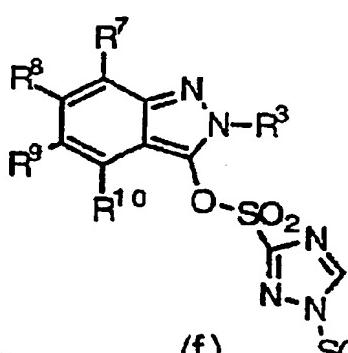
第 6 表 (続 き)

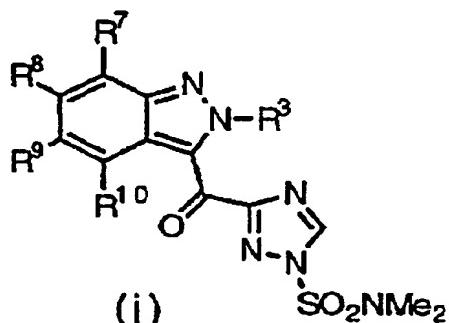
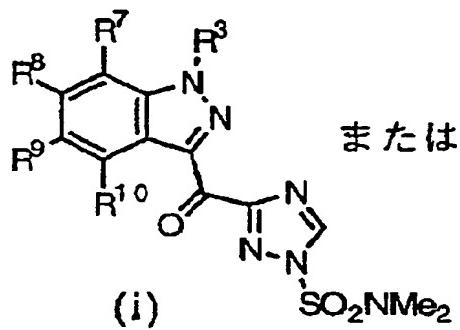
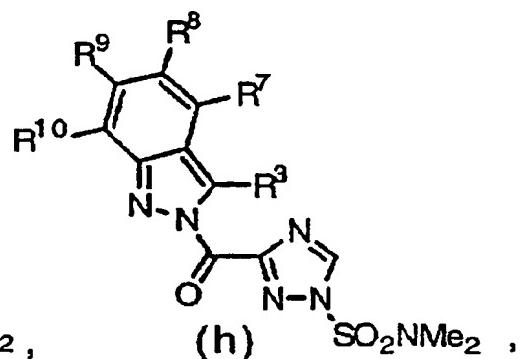
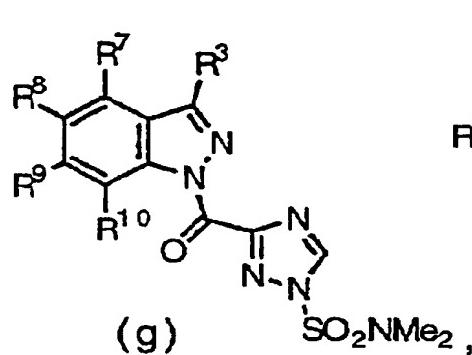
化合物No	R ³	R ⁴	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
6 - 179	H	Me	Me	C1	H	H	H
6 - 180	H	Me	Me	H	C1	H	H
6 - 181	H	Me	Me	H	H	C1	H
6 - 182	H	Me	Me	H	H	H	C1
6 - 183	H	Me	C1	Me	H	H	H
6 - 184	H	Me	H	Me	C1	H	H
6 - 185	H	Me	H	Me	H	C1	H
6 - 186	H	Me	H	Me	H	H	C1
6 - 187	H	Me	C1	H	Me	H	H
6 - 188	H	Me	H	C1	Me	H	H
6 - 189	H	Me	C1	C1	H	H	H
6 - 190	H	Me	C1	H	C1	H	H
6 - 191	H	Me	C1	H	H	C1	H
6 - 192	H	Me	C1	H	H	H	C1
6 - 193	H	Me	H	C1	C1	H	H
6 - 194	H	Me	H	C1	H	C1	H
6 - 195	C1	Me	Me	C1	H	H	H
6 - 196	C1	Me	Me	H	C1	H	H
6 - 197	C1	Me	Me	H	H	C1	H
6 - 198	C1	Me	Me	H	H	H	C1
6 - 199	C1	Me	C1	Me	H	H	H
6 - 200	C1	Me	H	Me	C1	H	H
6 - 201	C1	Me	H	Me	H	C1	H
6 - 202	C1	Me	H	Me	H	H	C1
6 - 203	C1	Me	C1	H	Me	H	H
6 - 204	C1	Me	H	C1	Me	H	H
6 - 205	C1	Me	C1	C1	H	H	H
6 - 206	C1	Me	C1	H	C1	H	H
6 - 207	C1	Me	C1	H	H	C1	H
6 - 208	C1	Me	C1	H	H	H	C1
6 - 209	C1	Me	H	C1	C1	H	H
6 - 210	C1	Me	H	C1	H	C1	H
6 - 211	Br	Me	Me	C1	H	H	H
6 - 212	Br	Me	Me	H	C1	H	H
6 - 213	Br	Me	Me	H	H	C1	H
6 - 214	Br	Me	Me	H	H	H	C1
6 - 215	Br	Me	Me	C1	H	H	H
6 - 216	Br	Me	H	Me	C1	H	H
6 - 217	Br	Me	H	Me	H	C1	H
6 - 218	Br	Me	H	Me	H	H	C1
6 - 219	Br	Me	C1	H	Me	H	H
6 - 220	Br	Me	H	C1	Me	H	H
6 - 221	Br	Me	C1	C1	H	H	H
6 - 222	Br	Me	C1	H	C1	H	H

第 6 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
6 - 223	Br	Me	Cl	H	H	Cl	H
6 - 224	Br	Me	Cl	H	H	H	Cl
6 - 225	Br	Me	H	Cl	Cl	H	H
6 - 226	Br	Me	H	Cl	H	Cl	H

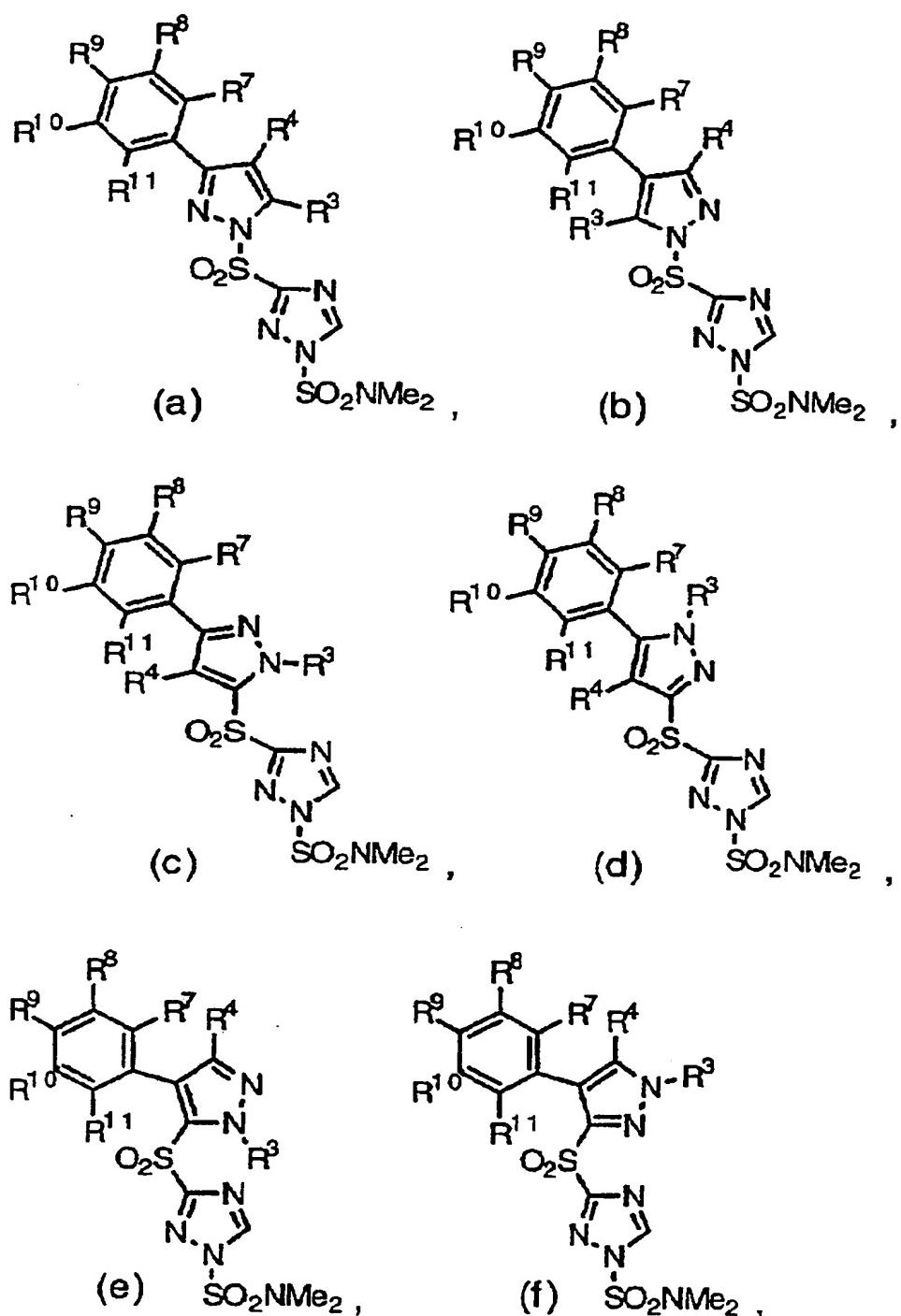
第 7 表

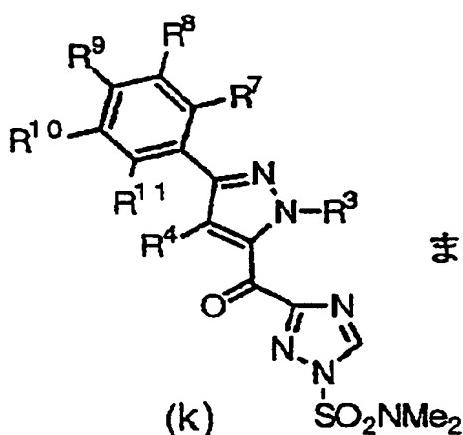
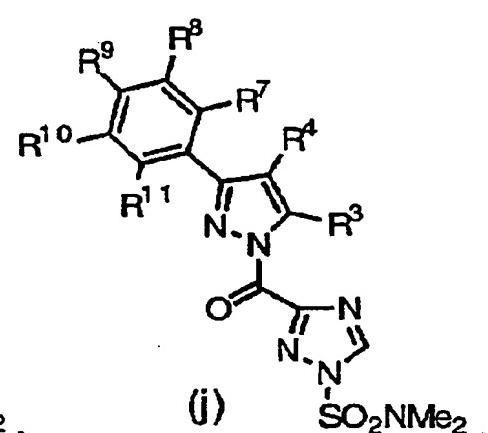
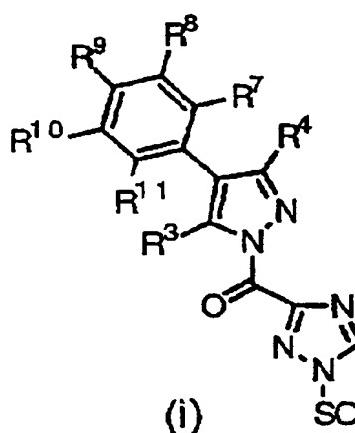
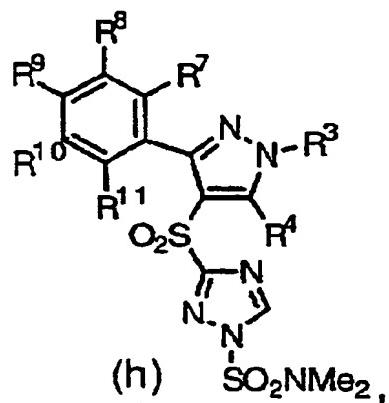
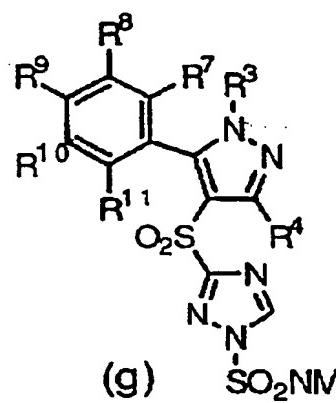
(a) SO_2NMe_2 ,(b) SO_2NMe_2 ,(c) SO_2NMe_2 ,(d) SO_2NMe_2 ,(e) SO_2NMe_2 ,(f) SO_2NMe_2



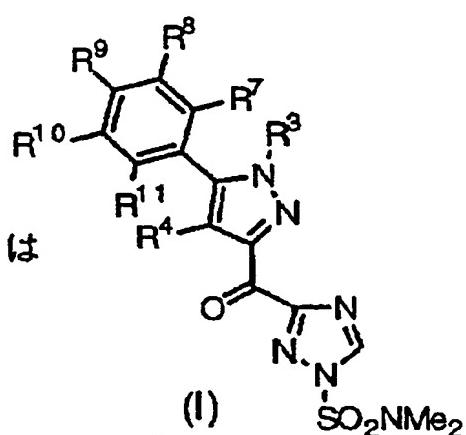
化合物 No	R ³	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰
7 - 1	H	H	H	H	H
7 - 2	Me	H	H	H	H
7 - 3	Et	H	H	H	H
7 - 4	Ph	H	H	H	H
7 - 5	Cl	H	H	H	H
7 - 6	Br	H	H	H	H
7 - 7	CF ₃	H	H	H	H
7 - 8	H	Cl	H	H	H
7 - 9	H	H	Cl	H	H
7 - 10	H	H	H	Cl	H
7 - 11	H	H	H	H	Cl
7 - 12	H	Br	H	H	H
7 - 13	H	H	Br	H	H
7 - 14	H	H	H	Br	H
7 - 15	H	H	H	H	Br

第 8 表





または



化合物No	R ³	R ⁴	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
8 - 1	H	H	H	H	H	H	H
8 - 2	H	Cl	H	H	H	H	H
8 - 3	H	Br	H	H	H	H	H
8 - 4	H	NO ₂	H	H	H	H	H
8 - 5	H	CO ₂ Me	H	H	H	H	H
8 - 6	H	CN	H	H	H	H	H
8 - 7	H	Me	H	H	H	H	H
8 - 8	H	Et	H	H	H	H	H
8 - 9	H	Ph	H	H	H	H	H
8 - 10	Me	H	H	H	H	H	H
8 - 11	Me	Cl	H	H	H	H	H
8 - 12	Me	Br	H	H	H	H	H
8 - 13	Me	NO ₂	H	H	H	H	H
8 - 14	Me	CO ₂ Me	H	H	H	H	H
8 - 15	Me	CN	H	H	H	H	H
8 - 16	Me	Me	H	H	H	H	H
8 - 17	Me	Et	H	H	H	H	H
8 - 18	Me	Ph	H	H	H	H	H
8 - 19	Et	H	H	H	H	H	H
8 - 20	Et	Cl	H	H	H	H	H
8 - 21	Et	Br	H	H	H	H	H
8 - 22	Et	NO ₂	H	H	H	H	H
8 - 23	Et	CO ₂ Me	H	H	H	H	H
8 - 24	Et	CN	H	H	H	H	H
8 - 25	Et	Me	H	H	H	H	H
8 - 26	Et	Et	H	H	H	H	H
8 - 27	Et	Ph	H	H	H	H	H
8 - 28	n - Pr	H	H	H	H	H	H
8 - 29	n - Pr	Cl	H	H	H	H	H
8 - 30	n - Pr	Br	H	H	H	H	H
8 - 31	n - Pr	NO ₂	H	H	H	H	H
8 - 32	n - Pr	CO ₂ Me	H	H	H	H	H
8 - 33	n - Pr	CN	H	H	H	H	H
8 - 34	n - Pr	Me	H	H	H	H	H
8 - 35	n - Pr	Et	H	H	H	H	H
8 - 36	n - Pr	Ph	H	H	H	H	H
8 - 37	Cl	H	H	H	H	H	H
8 - 38	Cl	Cl	H	H	H	H	H
8 - 39	Cl	Br	H	H	H	H	H
8 - 40	Cl	NO ₂	H	H	H	H	H
8 - 41	Cl	CO ₂ Me	H	H	H	H	H
8 - 42	Cl	CN	H	H	H	H	H
8 - 43	Cl	Me	H	H	H	H	H
8 - 44	Cl	Et	H	H	H	H	H
8 - 45	Cl	Ph	H	H	H	H	H
8 - 46	Br	H	H	H	H	H	H

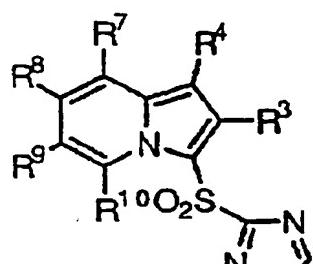
第 8 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
8 - 47	Br	Cl	H	H	H	H	H
8 - 48	Br	Br	H	H	H	H	H
8 - 49	Br	NO ₂	H	H	H	H	H
8 - 50	Br	CO ₂ Me	H	H	H	H	H
8 - 51	Br	CN	H	H	H	H	H
8 - 52	Br	Me	H	H	H	H	H
8 - 53	Br	Et	H	H	H	H	H
8 - 54	Br	Ph	H	H	H	H	H
8 - 55	CF ₃	H	H	H	H	H	H
8 - 56	CF ₃	Cl	H	H	H	H	H
8 - 57	CF ₃	Br	H	H	H	H	H
8 - 58	CF ₃	NO ₂	H	H	H	H	H
8 - 59	CF ₃	CO ₂ Me	H	H	H	H	H
8 - 60	CF ₃	CN	H	H	H	H	H
8 - 61	CF ₃	Me	H	H	H	H	H
8 - 62	CF ₃	Et	H	H	H	H	H
8 - 63	CF ₃	Ph	H	H	H	H	H
8 - 64	Ph	H	H	H	H	H	H
8 - 65	Ph	Cl	H	H	H	H	H
8 - 66	Ph	Br	H	H	H	H	H
8 - 67	Ph	NO ₂	H	H	H	H	H
8 - 68	Ph	CO ₂ Me	H	H	H	H	H
8 - 69	Ph	CN	H	H	H	H	H
8 - 70	Ph	Me	H	H	H	H	H
8 - 71	Ph	Et	H	H	H	H	H
8 - 72	Ph	Ph	H	H	H	H	H
8 - 73	Me	Cl	Me	Me	H	H	H
8 - 74	Me	Cl	H	H	Me	H	H
8 - 75	Me	Cl	H	H	H	Me	H
8 - 76	Me	Cl	Cl	H	H	H	H
8 - 77	Me	Cl	H	Cl	H	H	H
8 - 78	Me	Cl	H	H	Cl	H	H
8 - 79	Me	Cl	Br	H	H	H	H
8 - 80	Me	Cl	H	Br	H	H	H
8 - 81	Me	Cl	H	H	Br	H	H
8 - 82	Me	Cl	CF ₃	H	H	H	H
8 - 83	Me	Cl	H	CF ₃	H	H	H
8 - 84	Me	Cl	H	H	CF ₃	H	H
8 - 85	Me	Br	Me	H	H	H	H
8 - 86	Me	Br	H	Me	H	H	H
8 - 87	Me	Br	H	H	Me	H	H
8 - 88	Me	Br	C1	H	H	H	H
8 - 89	Me	Br	H	C1	H	H	H
8 - 90	Me	Br	H	H	C1	H	H

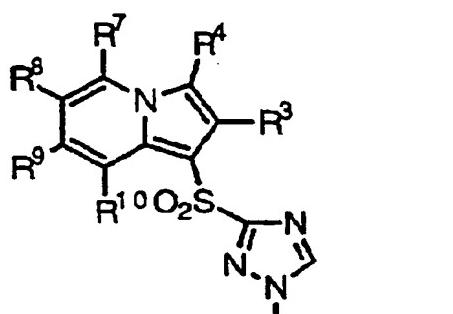
第 8 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
8 - 91	Me	Br	Br	H	H	H	H
8 - 92	Me	Br	H	Br	H	H	H
8 - 93	Me	Br	H	H	Br	H	H
8 - 94	Me	Br	CF ₃	H	H	H	H
8 - 95	Me	Br	H	CF ₃	H	H	H
8 - 96	Me	Br	H	H	CF ₃	H	H

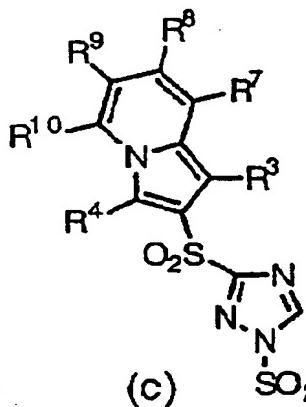
第 9 表



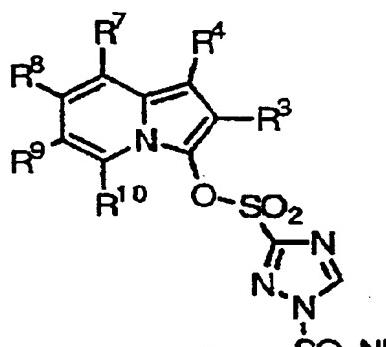
(a)



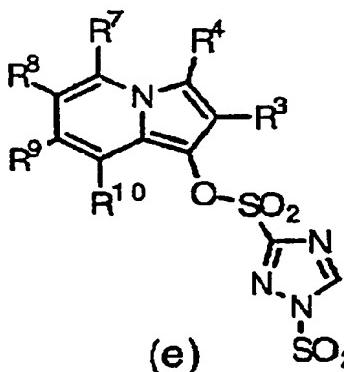
(b)



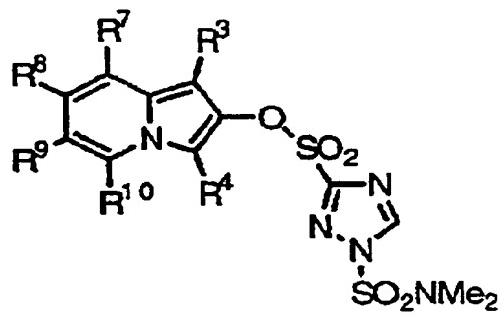
(c)



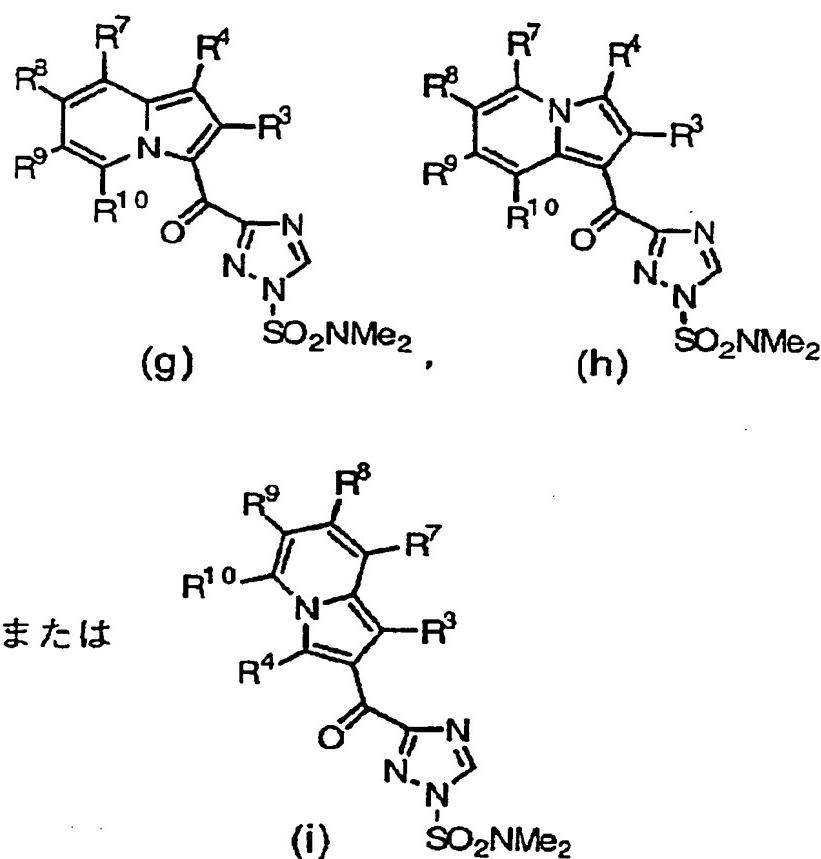
(d)



(e)



(f)



化合物No	R ³	R ⁴	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰
9 - 1	H	H	H	H	H	H
9 - 2	H	Cl	H	H	H	H
9 - 3	H	Br	H	H	H	H
9 - 4	H	NO ₂	H	H	H	H
9 - 5	H	CN	H	H	H	H
9 - 6	H	CF ₃	H	H	H	H
9 - 7	H	Me	H	H	H	H
9 - 8	H	Et	H	H	H	H
9 - 9	H	SMe	H	H	H	H
9 - 10	H	CO ₂ Me	H	H	H	H
9 - 11	Me	H	H	H	H	H
9 - 12	Me	Cl	H	H	H	H
9 - 13	Me	Br	H	H	H	H
9 - 14	Me	NO ₂	H	H	H	H
9 - 15	Me	CN	H	H	H	H
9 - 16	Me	CF ₃	H	H	H	H

第 9 表 (続 き)

化合物 No	R ³	R ⁴	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰
9 - 17	Me	Me	H	H	H	H
9 - 18	Me	Et	H	H	H	H
9 - 19	Me	SMe	H	H	H	H
9 - 20	Me	CO ₂ Me	H	H	H	H
9 - 21	Et	H	H	H	H	H
9 - 22	Et	Cl	H	H	H	H
9 - 23	Et	Br	H	H	H	H
9 - 24	Et	NO ₂	H	H	H	H
9 - 25	Et	CN	H	H	H	H
9 - 26	Et	CF ₃	H	H	H	H
9 - 27	Et	Me	H	H	H	H
9 - 28	Et	Et	H	H	H	H
9 - 29	Et	SMe	H	H	H	H
9 - 30	Et	CO ₂ Me	H	H	H	H
9 - 31	Cl	H	H	H	H	H
9 - 32	Cl	Me	H	H	H	H
9 - 33	Cl	Et	H	H	H	H
9 - 34	Cl	CN	H	H	H	H
9 - 35	Cl	CF ₃	H	H	H	H
9 - 36	Cl	Cl	H	H	H	H
9 - 37	Cl	Br	H	H	H	H
9 - 38	Cl	NO ₂	H	H	H	H
9 - 39	Cl	SMe	H	H	H	H
9 - 40	Cl	CO ₂ Me	H	H	H	H
9 - 41	Br	H	H	H	H	H
9 - 42	Br	Me	H	H	H	H
9 - 43	Br	Et	H	H	H	H
9 - 44	Br	CN	H	H	H	H
9 - 45	Br	CF ₃	H	H	H	H
9 - 46	Br	Cl	H	H	H	H
9 - 47	Br	Br	H	H	H	H
9 - 48	Br	NO ₂	H	H	H	H
9 - 49	Br	SMe	H	H	H	H
9 - 50	Br	CO ₂ Me	H	H	H	H
9 - 51	CF ₃	H	H	H	H	H
9 - 52	CF ₃	Me	H	H	H	H
9 - 53	CF ₃	Et	H	H	H	H
9 - 54	CF ₃	CN	H	H	H	H
9 - 55	CF ₃	CF ₃	H	H	H	H
9 - 56	CF ₃	Cl	H	H	H	H
9 - 57	CF ₃	Br	H	H	H	H
9 - 58	CF ₃	NO ₂	H	H	H	H
9 - 59	CF ₃	SMe	H	H	H	H
9 - 60	CF ₃	CO ₂ Me	H	H	H	H

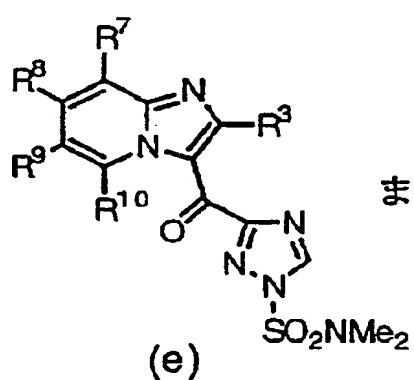
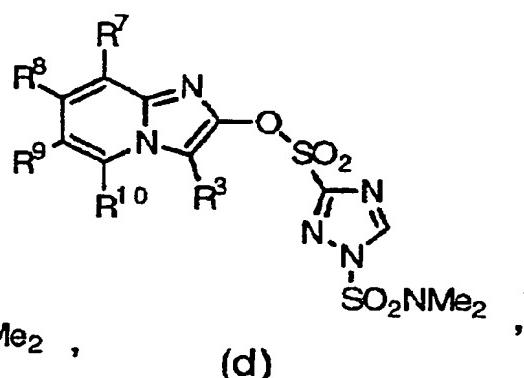
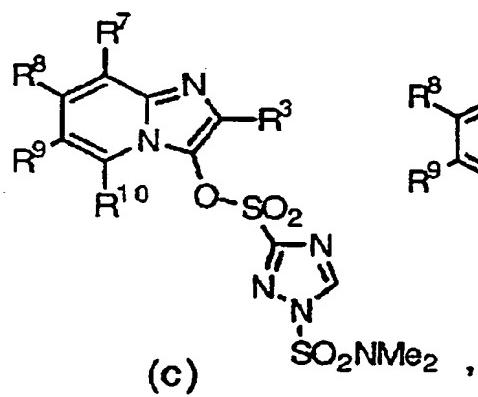
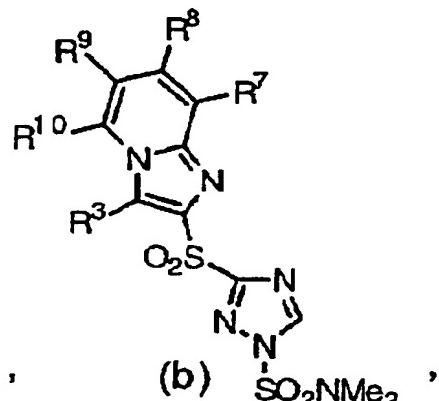
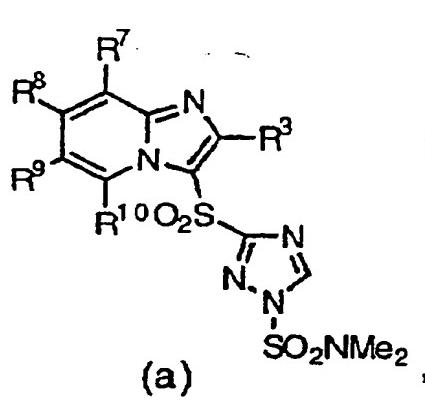
第 9 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰
9 - 61	SMe	H	H	H	H	H
9 - 62	SMe	Cl	H	H	H	H
9 - 63	SMe	Br	H	H	H	H
9 - 64	SMe	NO ₂	H	H	H	H
9 - 65	SMe	CN	H	H	H	H
9 - 66	SMe	CF ₃	H	H	H	H
9 - 67	SMe	Me	H	H	H	H
9 - 68	SMe	Et	H	H	H	H
9 - 69	SMe	SMe	H	H	H	H
9 - 70	SMe	CO ₂ Me	H	H	H	H
9 - 71	CN	H	H	H	H	H
9 - 72	CN	Me	H	H	H	H
9 - 73	CN	Et	H	H	H	H
9 - 74	CN	CN	H	H	H	H
9 - 75	CN	CF ₃	H	H	H	H
9 - 76	CN	Cl	H	H	H	H
9 - 77	CN	Br	H	H	H	H
9 - 78	CN	NO ₂	H	H	H	H
9 - 79	CN	SMe	H	H	H	H
9 - 80	CN	CO ₂ Me	H	H	H	H
9 - 81	Me	H	Me	H	H	H
9 - 82	Me	H	H	Me	H	H
9 - 83	Me	H	H	H	Me	H
9 - 84	Me	H	H	H	H	Me
9 - 85	Me	H	F	H	H	H
9 - 86	Me	H	H	F	H	H
9 - 87	Me	H	H	H	F	H
9 - 88	Me	H	H	H	H	F
9 - 89	Me	H	Cl	H	H	H
9 - 90	Me	H	H	Cl	H	H
9 - 91	Me	H	H	H	Cl	H
9 - 92	Me	H	H	H	H	Cl
9 - 93	Me	H	Br	H	H	H
9 - 94	Me	H	H	Br	H	H
9 - 95	Me	H	H	H	Br	H
9 - 96	Me	H	H	H	H	Br
9 - 97	Me	Cl	Me	H	H	H
9 - 98	Me	Cl	H	Me	H	H
9 - 99	Me	Cl	H	H	Me	H
9 - 100	Me	Cl	H	H	H	Me
9 - 101	Me	Cl	F	H	H	H
9 - 102	Me	Cl	H	F	H	H
9 - 103	Me	Cl	H	H	F	H
9 - 104	Me	Cl	H	H	H	F

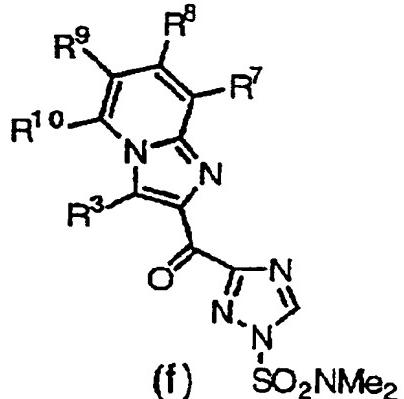
第 9 表 (続 き)

化合物No	R ³	R ⁴	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰
9 - 105	Me	Cl	Cl	H	H	H
9 - 106	Me	Cl	H	Cl	H	H
9 - 107	Me	Cl	H	H	Cl	H
9 - 108	Me	Cl	H	H	H	Cl
9 - 109	Me	Cl	Br	H	H	H
9 - 110	Me	Cl	H	Br	H	H
9 - 111	Me	Cl	H	H	Br	H
9 - 112	Me	Cl	H	H	H	Br
9 - 113	Me	Br	Me	H	H	H
9 - 114	Me	Br	H	Me	H	H
9 - 115	Me	Br	H	H	Me	H
9 - 116	Me	Br	H	H	H	Me
9 - 117	Me	Br	F	H	H	H
9 - 118	Me	Br	H	F	H	H
9 - 119	Me	Br	H	H	F	H
9 - 120	Me	Br	H	H	H	F
9 - 121	Me	Br	Cl	H	H	H
9 - 122	Me	Br	H	Cl	H	H
9 - 123	Me	Br	H	H	Cl	H
9 - 124	Me	Br	H	H	H	Cl
9 - 125	Me	Br	Br	H	H	H
9 - 126	Me	Br	H	Br	H	H
9 - 127	Me	Br	H	H	Br	H
9 - 128	Me	Br	H	H	H	Br

第 10 表



または

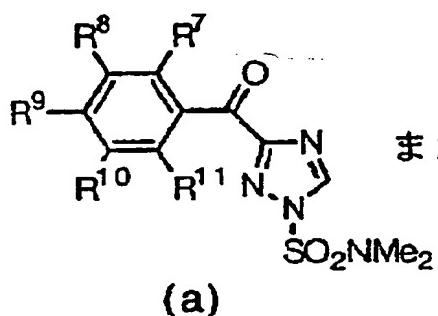


化合物 No	R ³	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰
10 - 1	H	H	H	H	H
10 - 2	Me	H	H	H	H
10 - 3	Et	H	H	H	H
10 - 4	n - Pr	H	H	H	H
10 - 5	Cl	H	H	H	H
10 - 6	Br	H	H	H	H
10 - 7	SMe	H	H	H	H
10 - 8	CF ₃	H	H	H	H
10 - 9	CN	H	H	H	H
10 - 10	H	Me	H	H	H
10 - 11	H	H	Me	H	H
10 - 12	H	H	H	Me	Me
10 - 13	H	H	H	H	Me
10 - 14	H	F	H	H	H
10 - 15	H	H	F	H	H
10 - 16	H	H	H	F	H
10 - 17	H	H	H	H	F
10 - 18	H	Cl	H	H	H
10 - 19	H	H	Cl	H	H
10 - 20	H	H	H	Cl	H
10 - 21	H	H	H	H	Cl
10 - 22	H	Br	H	H	H
10 - 23	H	H	Br	H	H
10 - 24	H	H	H	Br	H
10 - 25	H	H	H	H	Br
10 - 26	Me	Me	H	H	H
10 - 27	Me	H	Me	H	H
10 - 28	Me	H	H	Me	H
10 - 29	Me	H	H	H	Me
10 - 30	Me	F	H	H	H
10 - 31	Me	H	F	H	H
10 - 32	Me	H	H	F	H
10 - 33	Me	H	H	H	F
10 - 34	Me	Cl	H	H	H
10 - 35	Me	H	Cl	H	H
10 - 36	Me	H	H	Cl	H
10 - 37	Me	H	H	H	Cl
10 - 38	Me	Br	H	H	H
10 - 39	Me	H	Br	H	H
10 - 40	Me	H	H	Br	H
10 - 41	Me	H	H	H	Br
10 - 42	Et	Me	H	H	H
10 - 43	Et	H	Me	H	H
10 - 44	Et	H	H	Me	H
10 - 45	Et	H	H	H	Me
10 - 46	Et	F	H	H	H

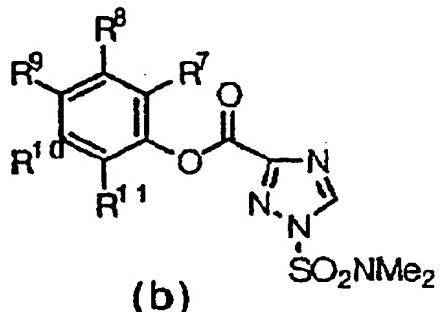
第 10 表 (続き)

化合物No	R ³	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰
10 - 47	Et	H	F	H	H
10 - 48	Et	H	H	F	H
10 - 49	Et	H	H	H	F
10 - 50	Et	C1	H	H	H
10 - 51	Et	H	C1	H	H
10 - 52	Et	H	H	C1	H
10 - 53	Et	H	H	H	C1
10 - 54	Et	Br	H	H	H
10 - 55	Et	H	Br	H	H
10 - 56	Et	H	H	Br	H
10 - 57	Et	H	H	H	Br
10 - 58	C1	Me	H	H	H
10 - 59	C1	H	Me	H	H
10 - 60	C1	H	H	Me	H
10 - 61	C1	H	H	H	Me
10 - 62	C1	F	H	H	H
10 - 63	C1	H	F	H	H
10 - 64	C1	H	H	F	H
10 - 65	C1	H	H	H	F
10 - 66	C1	C1	H	H	H
10 - 67	C1	H	C1	H	H
10 - 68	C1	H	H	C1	H
10 - 69	C1	H	H	H	C1
10 - 70	C1	Br	H	H	H
10 - 71	C1	H	Br	H	H
10 - 72	C1	H	H	Br	H
10 - 73	C1	H	H	H	Br
10 - 74	Br	Me	H	H	H
10 - 75	Br	H	Me	H	H
10 - 76	Br	H	H	Me	H
10 - 77	Br	H	H	H	Me
10 - 78	Br	F	H	H	H
10 - 79	Br	H	F	H	H
10 - 80	Br	H	H	F	H
10 - 81	Br	H	H	H	F
10 - 82	Br	C1	H	H	H
10 - 83	Br	H	C1	H	H
10 - 84	Br	H	H	C1	H
10 - 85	Br	H	H	H	C1
10 - 86	Br	Br	H	H	H
10 - 87	Br	H	Br	H	H
10 - 88	Br	H	H	Br	H
10 - 89	Br	H	H	H	Br

第 11 表



まなは



化合物 N o	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
11 - 1	H	H	H	H	H
11 - 2	Me	H	H	H	H
11 - 3	H	Me	H	H	H
11 - 4	H	H	Me	H	H
11 - 5	Et	H	H	H	H
11 - 6	H	Et	H	H	H
11 - 7	H	H	Et	H	H
11 - 8	F	H	H	H	H
11 - 9	H	F	H	H	H
11 - 10	H	H	F	H	H
11 - 11	Cl	H	H	H	H
11 - 12	H	Cl	H	H	H
11 - 13	H	H	Cl	H	H
11 - 14	Br	H	H	H	H
11 - 15	H	Br	H	H	H
11 - 16	H	H	Br	H	H
11 - 17	CF ₃	H	H	H	H
11 - 18	H	CF ₃	H	H	H
11 - 19	H	H	CF ₃	H	H
11 - 20	OCF ₃	H	H	H	H
11 - 21	H	OCF ₃	H	H	H
11 - 22	H	H	OCF ₃	H	H
11 - 23	Ph	H	H	H	H
11 - 24	H	Ph	H	H	H
11 - 25	H	H	Ph	H	H
11 - 26	OPh	H	H	H	H
11 - 27	H	OPh	H	H	H
11 - 28	H	H	OPh	H	H
11 - 29	Bn	H	H	H	H

第 11 表(続き)

化合物No	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹
11-30	H	Bn	H	H	H
11-31	H	H	Bn	H	H
11-32	CO ₂ Me	H	H	H	H
11-33	H	CO ₂ Me	H	H	H
11-34	H	H	CO ₂ Me	H	H
11-35	CN	H	H	H	H
11-36	H	CN	H	H	H
11-37	H	H	CN	H	H
11-38	NO ₂	H	H	H	H
11-39	H	NO ₂	H	H	H
11-40	H	H	NO ₂	H	H
11-41	OMe	H	H	H	H
11-42	H	OMe	H	H	H
11-43	H	H	OMe	H	H
11-44	Me	Cl	H	H	H
11-45	Me	H	Cl	H	H
11-46	Me	H	H	Cl	H
11-47	Me	H	H	H	Cl
11-48	Cl	Me	H	H	H
11-49	H	Me	Cl	H	H
11-50	H	Me	H	Cl	H
11-51	H	Me	H	H	Cl
11-52	Cl	H	Me	H	H
11-53	H	Cl	Me	H	H
11-54	Me	Me	H	H	H
11-55	Me	H	Me	H	H
11-56	Me	H	H	Me	H
11-57	Me	H	H	H	Me
11-58	H	Me	Me	H	H
11-59	H	Me	H	Me	H
11-60	Cl	Cl	H	H	H
11-61	Cl	H	Cl	H	H
11-62	Cl	H	H	Cl	H
11-63	Cl	H	H	H	Cl
11-64	H	Cl	Cl	H	H
11-65	H	Cl	H	Cl	H

次に本発明化合物の製造法について以下に説明するが、これら方法のみに限定されるものではない。

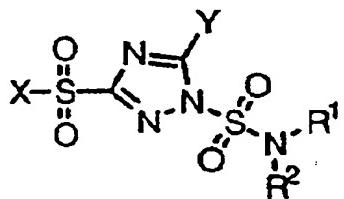
(製法 1)

式 (2)

A - H (2)

(式中Aは前記と同じ意味を表す。)で表される化合物と、

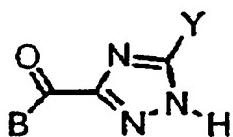
式(3)



(式中R¹, R², Yは前記と同じ意味を表し、Xはハロゲンを表す。)で表される化合物を反応させることによって本発明化合物を製造することができる。

(製法2)

式(4)



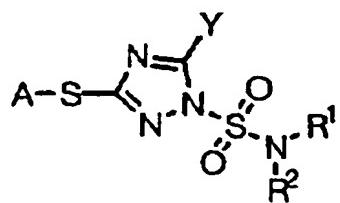
(式中B, Yは前記と同じ意味を表す。)で表される化合物と、

式(5)

R¹R²N₂SO₂X (式中R¹, R²は前記と同じ意味を表し、Xはハロゲンを表す。)で表される化合物を反応させることによって本発明化合物を製造することができる。

(製法3)

式(6)



(式中 R¹, R², A, Y は前記と同じ意味を表す。) で表される化合物を酸化剤で酸化することによって本発明化合物を製造することができる。

(製法 1)において、(2)とハロスルホニルトリアゾール(3)を塩基存在下で反応させることにより、スルファモイル誘導体(1)を合成することができる。

溶媒は反応に対して不活性であればよく、例えばジオキサン、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、トルエン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族炭化水素類、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭素類、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、ピリジン、トリエチルアミン、トリブチルアミン等の第3級アミン類、N, N-ジメチルホルムアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の硫黄化合物、ニトロエタン、ニトロベンゼン等のニトロ化合物、酢酸エチル等のエステル類、あるいはそれらの混合物が用いられる。反応温度は-78 °Cから溶媒の沸点の間で行うことができる。

塩基としては、例えば、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、ジエチルイソプロピルアミン、N, N-ジエチルアニリン等の有機塩基、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基、水素化ナトリウム等の金属水素化物、ナトリウムメトキシド、カリウムt-ブトキシド等の金属アルコキシド、リチウムジイソプロピルアミド等の有機金属アミド、n-ブチルリチウム等の有機金属化合物を用いることができる。

(製法 2)において、(4)とジアルキルスルファモイルハライド(5)を塩

基存在下反応させることにより、スルファモイル誘導体（1）を合成することができる。

溶媒は反応に対して不活性であればよく、例えばジオキサン、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、トルエン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族炭化水素類、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭素類、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、ピリジン、トリエチルアミン、トリブチルアミン等の第3級アミン類、N, N-ジメチルホルムアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の硫黄化合物、ニトロエタン、ニトロベンゼン等のニトロ化合物、酢酸エチル等のエステル類、あるいはそれらの混合物が用いられる。反応温度は-78°Cから溶媒の沸点の間で行うことができる。

塩基としては、例えば、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、ジエチルイソプロピルアミン、N, N-ジエチルアニリン等の有機塩基、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の無機塩基、水素化ナトリウム等の金属水素化物、ナトリウムメトキシド、カリウムt-ブトキシド等の金属アルコキシド、リチウムジイソプロピルアミド等の有機金属アミド、n-ブチルリチウム等の有機金属化合物を用いることができる。

（製法3）において、（6）を酸化剤で酸化することにより、スルファモイル誘導体（1）を合成することができる。

溶媒は反応に対して不活性であればよく、例えばジオキサン、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、トルエン、キシレン、クロロベンゼン等の芳香族炭化水素類、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭素類、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、N, N-ジメチルホルムアミド等のアミド類、酢酸エチル等のエステル類、酢酸等のカルボン酸類、水、あるいはそれらの混合物が用いられる。反応温度は-78°Cから溶媒の沸点の間で行うことができる。

酸化剤としては、例えば、過酸化水素、過酢酸、3-クロロ過安息香酸、過炭酸ナトリウム等の過酸化物を用いることができる。

尚、本法の出発原料である化合物(2)、(3)、(4)および(6)はそれぞれ公知の方法（例えば化合物(2)については大有機化学14巻299～514頁、化合物(3)については特開平5-43557号、特開平7-215971号公報、化合物(4)についてはChem. Pharm. Bull. 41(7) 1226-1231(1993)、化合物(6)については特開平9-143181参照）あるいはそれに準じた方法により容易に合成することができる。

次に、本発明化合物の防除対象となる植物病害としては、イネのいもち病(*Pyricularia oryzae*)、ごま葉枯病(*Cochliobolus miyabeanus*)、紋枯病(*Rhizoctonia solani*)、ムギ類のうどんこ病(*Erysiphe graminis f.sp. hordei, f.sp. tritici*)、斑葉病(*Pyrenophora graminea*)：網斑病(*Pyrenophora teres*)、赤かび病(*Gibberella zae*)、さび病(*Puccinia striiformis, P. graminis, P. recondita, P. hordei*)、雪腐病(*Tipula sp., Micronectriella nivais*)、裸黒穂病(*Ustilago tritici, U. nuda*)、アイスポット(*Pseudocercospora herpotrichoides*)、雲形病(*Rhynchosporium secalis*)、葉枯病(*Septoria tritici*)、ふ枯病(*Leptosphaeria nodorum*)、
カンキツの黒点病(*Diaporthe citri*)、そうか病(*Elsinoe fawcetti*)、果実腐敗病(*Penicillium digitalum, P. italicum*)、リンゴのモニリア病(*Selotinia mali*)、腐らん病(*Valsa mali*)、うどんこ病(*Podosphaera leucotricha*)、斑点落葉病(*Alternaria mali*)、黒星病(*Venturia inaequalis*)、ナシの黒星病(*Venturia nashicola*)、黒斑病(*Alternaria kikuchiana*)、赤星病(*Gymnosporangium haracanum*)、モモの灰星病(*Sclerolinia cinerea*)、黒星病(*Cleadosporium carpophilum*)、フォモプシス腐敗病(*Phomopsis sp.*)、
ブドウのべと病(*Plasmopara viticola*)、黒とう病(*Elsinoe ampelina*)、晩腐病(*Glomerella cingulata*)、うどんこ病(*Uncinula necator*)、さび病(*Phakopsora ampelopsidis*)、カキの炭そ病(*Gloeosporium kakj*)、落葉病(*Cercospora kakj, Mycosphaerella nawae*)、ウリ類のべと病(*Pseudoperenospora cubensis*)、炭そ病(*Colletotrichum lagenarium*)、うどんこ病(*Sphaerotheca fuliginea*)、つる枯病(*Mycosphaerella melonis*)、トマトの疫病(

Phytophthora infestans)、輪紋病 (*Alternaria solani*)、葉かび病 (*Cladosporium fulvum*)、

ナスの褐紋病 (*Phomopsis vexans*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracearum*)、アブラナ科野菜の黒斑病 (*Alternaria japonica*)、白斑病 (*Cercospora brassicae*)、ネギのさび病 (*Puccinia allii*)、ダイズの紫斑病 (*Cercospora kikuchii*)、黒とう病 (*Elsinoe glycines*)、黒点病 (*Diaporthe phaseolol*)、インゲンの炭そ病 (*Colletotrichum lindemuthianum*)、

ラッカセイの黒渋病 (*Mycosphaerella personatum*)、褐斑病 (*Cercospora arachidicola*)、エンドウのうどんこ病 (*Erysiphe pisi*)、ジャガイモの夏疫病 (*Alternaria solani*)、イチゴのうどんこ病 (*Sphaerotheca humuli*)、チャの網もち病 (*Exobasidium reticulatum*)、白星病 (*Elsinoe leucospila*)、タバコの赤星病 (*Alternaria lingipes*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracearum*)、炭そ病 (*Colletotrichum tabacum*)、テンサイの褐斑病 (*Cercospora beticola*)、バラの黒星病 (*Diplocarpon rosae*)、うどんこ病 (*Sphaerotheca pannosa*)、キクの褐斑病 (*Septoria chrysanthemi-indici*)、白さび病 (*Puccinia horiana*)、種々の作物の灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)、種々の作物の菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 等が挙げられる。

本発明化合物を農園芸用殺菌剤として使用するにあたっては、一般には適当な担体、例えばクレー、タルク、ベントナイト、珪藻土等の固体担体あるいは水、アルコール類 (メタノール、エタノール等)、芳香族炭化水素類 (ベンゼン、トルエン、メチルナフタレン等)、塩素化炭化水素類、エーテル類、ケトン類、エステル類 (酢酸エチル類)、酸アミド類 (ジメチルホルムアミド等) などの液体担体と混用して適用することができ、所望により乳化剤、分散剤、懸濁剤、浸透剤、展着剤、安定剤などを添加し、液剤、乳剤、水和剤、粉剤、粒剤、フロアブル剤等任意の剤型にて実用に供することができる。

本発明の化合物は、各種の殺菌剤、殺バクテリア剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺虫剤等の活性化合物、または他の生物学的に活性な化合物と混合もしくは併用して用いることができる。これらの活性物質の一般名を以下に具体的に列挙するが、これらのみに限定されるものではない。

殺菌剤活性化合物：アシベンゾラール（acibenzolar）、アムプロピルホス（ampropiprifos）、アニラジン（anilazine）、アザコナゾール（azaconazole）、アゾキシストロビン（azoxystrobin）、ベナラキシリ（benalaxyli）、ベノダニル（benodanil）、ベノミル（benomyl）、ベンザマクリル（benzamacril）、ビナパクリル（binapacryl）、ビフェニル（biphenyl）、ビテルタノール（bitertanol）、ベトキサジン（bethoxazine）、ボルドー液（bordeaux mixture）、プラストサイジン-S（blasticidin-S）、ブロモコナゾール（bromoconazole）、ブピリメート（bupirimate）、ブチオベート（buthiobate）、カルシウムポリスルフィド（calcium polysulfide）、キャプタフォール（captafol）、キャプタン（captan）、カッパーオキシクロリド（copper oxychloride）、カルプロパミド（carpropamid）、カルベンダジン（carbendazim）、カルボキシン（carboxin）、キノメチオネート（chinomethionat）、クロベンチアゾン（chlobenthiazone）、クロルフェナゾール（chlorfénazol）、クロロネブ（chloroneb）、クロロタロン（chlorothalonil）、クロゾリネート（chlozolinate）、クフラネブ（cufraneb）、シモキサニル（cymoxanil）、シプロコナゾール（cyproconazole）、シプロジニル（cyprodinil）、シプロフラン（cyprofuran）、デバカルブ（debacarb）、ジクロロフェン（dichlorophen）、ジクロブトラゾール（diclobutrazol）、ジクロフラン（diclofuanid）、ジクロメジン（diclomedine）、ジクロラン（dicloran）、ジエトフェンカルブ（diethofencarb）、ジクロシメット（diclocymet）、ジフェノコナゾール（difenoconazole）、ジフルメトリン（diflumetorim）、ジメチリモール（dimethirimol）、ジメトモルフ（dimethomorph）、ジニコナゾール（diniconazole）、ジニコナゾール-M（diniconazole-M）、ジノカップ（dinocap）、ジフェニルアミン（diphenylamine）、ジピリチオン（dipyrithione）、ジタリムホス（ditalimfos）、ジチアノン（dithianon）、ドデモルフ（dodemorph）、ドジン（dodine）、ドラゾクソロン（drazoxolon）、エデフェノホス（edifenphos）、エポキシコナゾール（epoxiconazole）、エタコナゾール（etaconazole）、エチリモル（ethirimol）、エトリジアノール（etridiazole）、ファモキサゾン（famoxadone）、フェ

ナリモル (fenarimol) 、フェブコナゾール (febuconazole) 、フェンフラム (fenfuram) 、
フェンピクロニル (fenpiclonil) 、フェンプロピジン (fenpropidin) 、フェン
プロピモルフ (fenpropimorph) 、フェンチン (fentin) 、フェルバン (ferbam) 、
フェリムゾン (ferimzone) 、フルアジナム (fluazinam) 、フルジオキソニル (fludioxonil) 、フルオロイミド (fluoroimide) 、フルキンコナゾール (fluquinconazole) 、フルシラゾール (flusilazole) 、フルスルファミド (flusulfamide) 、フルトラニル (flutolanil) 、フルトリアフォール (flutriafol) 、フォ
ルペット (folpet) 、フォセチル-アルミニウム (fosetyl-aluminium) 、
フベリダゾール (fuberidazole) 、フララキシリ (furalaxyli) 、フェナミドン (fenamidone) 、フェンヘキサミド (fenhexamid) 、グアザチン (guazatine) 、ヘ
キサクロロベンゼン (hexachlorobenzene) 、ヘキサコナゾール (hexaconazole) 、
ヒメキサゾール (hymexazol) 、イマザリル (imazalil) 、イミベンコナゾール (imibenconazole) 、イミノクタジン (iminoctadine) 、イプロコナゾール (ipronazole) 、イプロベンホス (iprobenfos) 、
イプロジオン (iprodione) 、イソプロチオラン (isoprothiolane) 、イプロバリ
カルブ (iprovalicarb) 、カスガマイシン (kasugamycin) 、クレスキシム-メチ
ル (kresoxim-methyl) 、マンカッパー (mancopper) 、マンコゼブ (mancozeb) 、
マンネブ (maneb) 、メパニピリム (mepanipyrim) 、メプロニル (mepronil) 、
メタラキシリ (metalaxyli) 、メトコナゾール (metconazole) 、メチラム (metiram) 、メトミノストロビン (metominostrobin) 、
ミクロブタニル (myclobutanil) 、ナバム (nabam) 、ニッケルビス (ジメチルジ
チオカーバメート) (nickel bis(dimethyldithiocarbamate)) 、ニトロタール-
イソプロピル (nitrothal-isopropyl) 、ヌアリモル (nuarimol) 、オクチリノ
ン (octhilinone) 、オフレース (ofurace) 、オキサジキシリ (oxadixyl) 、オ
キシカルボキシン (oxycarboxin) 、オキポコナゾールフマール酸塩 (oxpoconaz
ole fumarate) 、
ペフラゾエート (pefurzoate) 、ペンコナゾール (penconazole) 、ペンシクロン
(pencycuron) 、フタライド (phthalide) 、ピペラリン (piperalin) 、ポリオ

キシン (polyoxins) 、プロベナゾール (probenazole) 、プロクロラズ (prochloraz) 、プロシミドン (procymidone) 、プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb hydrochloride) 、プロピコナゾール (propiconazole) 、プロピネブ (propineb) 、ピラゾホス (pyrazophos) 、ピリフェノックス (pyrifenox) 、ピリメタニル (pyrimethanil) 、ピロキュロン (pyroquilon) 、キノキシフェン (quinoxyfen) 、キントゼン (quintozene) 、

硫黄 (sulfur) 、スピロキサミン (spiroxamine) 、テブコナゾール (tebuconazole) 、テクナゼン (tecnazene) 、テトラコナゾール (tetraconazole) 、チアベンドゾール (thiabendazole) 、チフルザミド (thifluzamide) 、チオファネット-メチル (thiophanate-methyl) 、チラム (thiram) 、トルクロホス-メチル (tolclofos-methyl) 、トリルフラン (tolylfluanid) 、トリアジメホン (triadimefon) 、トリアジメノール (toriadimenol) 、トリアゾキシド (triazoxide) 、トリシクラゾール (tricyclazole) 、トリデモルフ (tridemorph) 、トリフルミゾール (triflumizole) 、トリホリン (triforine) 、トリチコナゾール (triticonazole) 、バリダマイシン (validamycin) 、ビンクロゾリン (vinclozolin) 、ジネブ (zineb) 、ジラム (ziram) 。

殺バクテリア剤活性化合物：ストレプトマイシン (streptomycin) 、オキシテトラサイクリン (oxytetracycline) 、オキソリニックアシド (oxolinic acid) 。

殺線虫剤活性化合物：アルドキシカルブ (aldoxycarb) 、フォスチアゼート (fosthiazate) 、フォスチエタン (fosthietan) 、オキサミル (oxamyl) 、フェナミホス (fenamiphos) 。

殺ダニ剤活性化合物：アミトラズ (amitraz) 、ブロモプロピレート (bromopropylate) 、チノメチオネート (chinomethionat) 、クロロベンジラート (chlorobenzilate) 、クロフェンテジン (clofentezine) 、サイヘキサチン (cyhexatin e) 、ジコフォール (dicofol) 、ジエノクロール (dienochlor) 、エトキサゾール (etoxazole) 、フェナザキン (fenazaquin) 、フェンブタチノキシド (fenbutatin oxide) 、

フェンプロバトリン (fenpropatrhin) 、フェンプロキシメート (fenproximate) 、ハルフェンプロックス (halfenprox) 、ヘキシチアゾックス (hexythiazox) 、ミ

ルベメクチン (milbemectin) 、プロパルギット (propargite) 、ピリダベン (pyridaben) 、ピリミジフェン (pyrimidifen) 、テブフェンピラド (tebufenpyrad)) ,

殺虫剤活性化合物 : アバメクチン (abamectin) 、アセフェート (acephate) 、アセタミピリド (acetamiprid) 、アジンホスメチル (azinphos - methyl) 、ベンジオカルブ (bendiocarb) 、ベンフラカルブ (benfuracarb) 、ベンスルタップ (bensultap) 、ビフェントリン (bifenthrin) 、ブuproフェジン (buprofezin) 、ブトカルボキシン (butocarboxim) 、カルバリル (carbaryl) 、カルボフラン (carbofuran) 、カルボスルファン (carbosulfan) 、カルタップ (cartap) 、クロルフェナピル (chlorfenapyr) 、クロルピリホス (chlorpyrifos) 、クロルフェンビンホス (chlorfenvinphos) 、クロルフルアズロン (chlorfluazuron) 、クロチアニジン (clothianidin) 、クロマフェノジド (chromafenozide) 、クロピリホスメチル (chlorpyrifos - methyl) 、シフルトリ (cyfluthrin) 、ベーターシフルトリ (beta - cyfluthrin) 、シペルメトリ (cypermethrin) 、シロマジン (cyromazine) 、シハロトリ (cyhalothrin) 、ラムダーシハロトリ (lambda - cyhalothrin) 、デルタメトリ (deltamethrin) 、ジアフェンチウロン (diafenthuron) 、ダイアジノン (diazinon) 、ジアクロデン (diacloden) 、ジフルベンズロン (diflubenzuron) 、ジメチルビンホス (dimethylvinphos) 、ジオフェノラン (diofenolan) 、ジスルフォトン (disulfoton) 、ジメトエート (dimethoate) 、EPN、エスフェンバレート (esfenvalerate) 、エチオフェンカルブ (ethiofencarb) 、エチプロール (ethiprole) 、エトフェンプロックス (etofenprox) 、エトリムホス (etrimfos) 、フェニトロチオン (fenitrothion) 、フェノブカルブ (fenobucarb) 、フェノキシカーブ (fenoxy carb) 、フェンプロパトリン (fenpropathrin) 、フェンバレート (fenvalerate) 、フィプロニル (fipronil) 、フルシトリネート (flucythrinate) 、フルフェノクスウロン (flufenoxuron) 、フルフェンプロックス (flufenprox) 、タウフルバリネット (tau - fluvalinate) 、ホノホス (fonophos) 、フォルメタネート (formetanate) 、フォルモチオン (formothion) 、フラチオカルブ (furathiocarb) 、

ハロフェノジド (halofenozide) 、ヘキサフルムロン (hexaflumuron) 、ヒドラメチルノン (hydramethylnon) 、イミダクロブリド (imidacloprid) 、イソフェンホス (isofenphos) 、インドキサカルブ (indoxacarb) 、イソプロカルブ (isoprocarb) 、イソキサチオン (isoxathion) 、ルフェヌウロン (lufenuron) 、マラチオン (malathion) 、メタルデヒド (metaldehyde) 、メタミドホス (methamidophos) 、メチダチオン (methidathion) 、メタクリホス (methacrifos) 、メタルカルブ (metalcarb) 、メソミル (methomyl) 、メソプレン (methoprene) 、メトキシクロール (methoxychlor) 、メトキシフェノジド (methoxyfenozide) 、モノクロトホス (monocrotophos) 、ムスカルーレ (muscalure) 、ニテンピラム (nitenpyram) 、オメトエート (omethoate) 、オキシデメトン-メチル (oxydemeton-methyl) 、オキサミル (oxamyl) 、パラチオン (parathion) 、パラチオン-メチル (parathion-methyl) 、ペルメトリシン (permethrin) 、フェントエート (phentoate) 、フォキシム (phoxim) 、ホレート (phorate) 、ホサロン (phosalone) 、ホスマット (phosmet) 、ホスファミドン (phosphamidon) 、ピリミカルブ (pirimicarb) 、ピリミホス-メチル (pirimiphos-methyl) 、プロフェノホス (profenofos) 、ピメトロジン (pymetrozin) 、ピラクロホス (pyraclofos) 、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen) 、ロテノン (rotenone) 、スルプロホス (sulprofos) 、シラフルオフェン (silafluofen) 、スピノサド (spinosad) 、スルホテップ (sulfotep) 、テブフェノジド (tebfenozide) 、テフルベンズロン (teflubenzuron) 、テフルトリシン (tefluthrin) 、テルブホス (terbufos) 、テトラクロロビンホス (tetrachlorvinphos) 、チオジカルブ (thiodicarb) 、チアメトキサム (thiamethoxam) 、チオファノックス (thiofanox) 、チオメトン (thiometon) 、トルフェンピラド (tolfenpyrad) 、トラロメスリン (tralomethrin) 、トリクロルホン (trichlorfon) 、トリアズロン (triazuron) 、トリフルムロン (triflumuron) 、バミドチオン (vamidothion)。

本発明化合物の施用方法としては、農園芸用殺菌剤として使用する場合は、茎葉散布、土壤処理、種子消毒等があげられるが、通常当業者が利用する一般的な方法においても有効である。

また、必要に応じて製剤または散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤などと混合施用してもよい。本発明化合物の施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、対象病害、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール当たり 0.005~50 kg 程度が適当である。

次に、本発明化合物を有効成分とする殺菌剤の製剤例を示すがこれらのみに限定されるものではない。なお、以下の製剤例において「部」は重量部を意味する。

製剤例 1 乳剤

本発明化合物	· · · · ·	20 部
メチルナフタレン	· · · · ·	55 部
シクロヘキサン	· · · · ·	20 部
ソルポール 2680	· · · · ·	5 部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業（株）商品名)

以上を均一に混合して乳剤とする。使用に際しては上記乳剤を 50~2000 倍に希釈して有効成分量がヘクタール当たり 0.005~50 kg になるように散布する。

製剤例 2 水和剤

本発明化合物	· · · · ·	25 部
ジークライト P E P	· · · · ·	66 部
(カオリナイトとセリサイトの混合物：ジークライト工業（株）商品名)		

ソルポール 5039 · · · · · 4 部

(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名)

カーブレックス #80 · · · · · 3 部

(ホワイトカーボン：塩野義製薬（株）商品名)

リグニンスルホン酸カルシウム · · · · · 2 部

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

使用に際しては上記水和剤を 50~2000 倍に希釈して有効成分量がヘクタール当たり 0.005~50 kg になるように散布する。

製剤例 3 粉剤

本発明化合物	· · · · ·	3 部
カープレックス # 8 0	· · · · ·	0. 5 部
(ホワイトカーボン：塩野義製薬（株）商品名)		
クレー	· · · · ·	9.5 部
リン酸ジイソプロピル	· · · · ·	1. 5 部
以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。使用に際して上記粉剤を有効成分量が ヘクタール当たり 0. 005 ~ 50 kg になるように散布する。		

製剤例 4 粒剤

本発明化合物	· · · · ·	5 部
ベントナイト	· · · · ·	30 部
タルク	· · · · ·	64 部
リグニンスルホン酸カルシウム	· · · · ·	1 部
以上を均一に混合粉碎して少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒 し、乾燥して粒剤とする。使用に際して上記粒剤を有効成分量がヘクタール当た り 0. 005 ~ 50 kg になるように散布する。		

製剤例 5 フロアブル剤

本発明化合物	· · · · ·	25 部
ソルポール 3353	· · · · ·	5 部
(非イオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名)		
ルノックス 1000C	· · · · ·	0. 5 部
(陰イオン界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名)		
ザンサンガム（天然高分子）	· · · · ·	0. 2 部
安息香酸ソーダ	· · · · ·	0. 4 部
プロピレングリコール	· · · · ·	10 部
水	· · · · ·	58. 9 部

有効成分（本発明化合物）を除く上記の成分を均一に溶解し、ついで本発明化
合物を加えよく攪拌した後、サンドミルにて湿式粉碎してフロアブル剤を得る。
使用に際しては、上記フロアブル剤を 50 ~ 2000 倍に希釈して有効成分量
がヘクタール当たり 0. 005 ~ 50 kg になるように散布する。

発明を実施するための最良の形態

次に実施例により、本発明の内容を具体的に説明するが、本発明はこれらのみに限定されるべきものではない。

実施例 1

1 - (N, N-ジメチルスルファモイル) - 3 - (2-メチル-3-クロロインドール-1-イル) スルホニル-1, 2, 4-トリアゾールの製造 (1-3 3 (a))

2-メチル-3-クロロインドール 0. 6 g をテトラヒドロフラン 20 ml に溶解し水素化ナトリウム (55%以上) 0. 17 g を氷冷下攪拌しながら加えた。室温で1時間攪拌後、再び氷冷し、1-N, N-ジメチルスルファモイル-3-クロロスルホニル-1, 2, 4-トリアゾール 1. 0 g を加え、室温で3時間攪拌した。反応終了後、希塩酸を加え酢酸エチルで抽出した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィーにより精製して標題化合物 0. 73 g を得た。

実施例 2

1 - (N, N-ジメチルスルファモイル) - 3 - (3-クロロ-1-イル) スルホニル-1, 2, 4-トリアゾールの製造 (7-5 (a))

3-クロロインダゾール 0. 5 g をテトラヒドロフラン 20 ml に溶解しトリエチルアミン 0. 4 g を氷冷下攪拌しながら加えた。その後、1-N, N-ジメチルスルファモイル-3-クロロスルホニル-1, 2, 4-トリアゾール 0. 94 g を加え、室温で16時間攪拌した。反応終了後、希塩酸で中和後、酢酸エチルで抽出した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィーにより精製して標題化合物 0. 94 g を得た。

実施例 3

1 - (N, N-ジメチルスルファモイル) - 3 - (3-フェニル-4-クロロ-5-メチルピラゾール-1-イル) スルホニル-1, 2, 4-トリアゾールの製造 (8-1 1 (a))

3-フェニル-4-クロロ-5-メチルピラゾール 0. 56 g をテトラヒドロフラン 20 ml に溶解しトリエチルアミン 0. 47 g を氷冷下攪拌しながら加えた。その後、1-N, N-ジメチルスルファモイル-3-クロロスルホニル-1,

2, 4-トリアゾール 0.8 g を加え、室温で 16 時間攪拌した。反応終了後、希塩酸で中和し、酢酸エチルで抽出した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィーにより精製して標題化合物 1.04 g を得た。

実施例 4

1-ジメチルスルファモイル-3-(4-トリフルオロメチルベンゾイル)-1,2,4-トリアゾールの製造 (11-19 (a))

3-(4-トリフルオロメチルベンゾイル)-1,2,4-トリアゾール 0.31 g を DMF 3 ml に溶解し、炭酸カリウム 0.21 g を加えたのち、攪拌下室温にてジメチルスルファモイルクロリド 0.22 g を加えた。1.5 時間室温にて攪拌したのち水を加えて析出した結晶をろ取し、ジエチルエーテルで洗浄した。減圧下乾燥して標題化合物 0.31 g を得た。

実施例 5

1-ジメチルスルファモイル-3-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イルスルホニル)-1,2,4-トリアゾールの製造 (10-2 (a))

1-ジメチルスルファモイル-3-(2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イルスルフェニル)-1,2,4-トリアゾール 1.2 g をアセトニトリル 20 ml および水 20 ml の混合液に溶解し、室温にて過炭酸ナトウム 3.0 g を加えた。1 時間室温にて攪拌したのち、過炭酸ナトウム 3.0 g をさらに加えた。反応終了後、希塩酸で中和し、酢酸エチルで抽出した。溶媒を留去後、カラムクロマトグラフィーにより精製して標題化合物 0.3 g を得た。

次に、これらの方法に準じて製造した一般式 (1) の化合物の物性を第 12 表に示す。

第 12 表

化合物 N o	物性値 (融点 °C)
1-1(a)	98 - 100
1-2(a)	74 - 76
1-3(a)	70 - 72
1-4(a)	70 - 72
1-9(a)	136 - 139
1-10(a)	118 - 121

第 12 表 (続き)

化合物No	物性値 (融点 °C)
1 - 11(a)	138 - 139
1 - 12(a)	138 - 139
1 - 13(a)	96 - 98
1 - 14(a)	油状物
1 - 20(a)	125 - 126
1 - 21(a)	120 - 122
1 - 22(a)	118 - 121
1 - 23(a)	78 - 79
1 - 26(a)	141 - 142.5
1 - 27(a)	60 - 61
1 - 31(a)	158 - 161
1 - 32(a)	145.5 - 146.5
1 - 33(a)	120 - 122
1 - 34(a)	81 - 82
1 - 35(a)	71 - 72
1 - 38(a)	128 - 129
1 - 41(a)	151 - 154
1 - 42(a)	140 - 141
1 - 42(i)	油状物
1 - 42(k)	142 - 145
1 - 42(l)	167.5 - 171
1 - 43(a)	118.5 - 120
1 - 44(a)	149 - 150
1 - 45(a)	油状物
1 - 50(a)	124 - 126
1 - 51(a)	181 - 182
1 - 56(a)	94 - 95
1 - 57(a)	61 - 63
1 - 62(a)	147.5 - 149
1 - 63(a)	134.5 - 136
1 - 71(a)	159 - 159.5
1 - 72(a)	104 - 107
1 - 81(a)	163 - 165
1 - 105(a)	135 - 137
1 - 118(a)	137 - 140
1 - 119(a)	139 - 140
1 - 125(a)	129 - 131
1 - 126(a)	119 - 121
1 - 130(a)	142 - 145
1 - 131(a)	128 - 129
1 - 133(a)	113 - 115
1 - 135(a)	80 - 81
1 - 136(c)	134.5 - 135.5
1 - 148(a)	112 - 113

第 12 表 (続き)

化合物 N o	物性値 (融点 °C)
1 - 152(a)	120 - 122
1 - 161(a)	油状物
1 - 163(a)	134.5 - 136
1 - 168(a)	138 - 139.5
1 - 187(a)	172 - 174
1 - 188(a)	166 - 168
1 - 211(a)	94 - 95
1 - 222(a)	126 - 127
1 - 232(a)	172 - 174
1 - 233(a)	164 - 165
1 - 243(a)	油状物
1 - 258(a)	125 - 128
1 - 265(a)	142 - 143.5
1 - 266(a)	114 - 117
1 - 276(a)	177.5 - 179
1 - 276(j)	87 - 89
1 - 277(a)	132 - 133
1 - 283(a)	112 - 113
1 - 289(a)	138.5 - 139.5
1 - 290(a)	142 - 143
1 - 298(a)	90 - 92
1 - 311(a)	142 - 143
1 - 316(a)	65 - 66.5
1 - 316(j)	91 - 92
1 - 326(a)	82 - 84
1 - 343(a)	油状物
1 - 353(a)	160 - 163
1 - 370(a)	油状物
1 - 378(a)	93 - 94
1 - 396(a)	149 - 151
1 - 403(a)	129 - 131
1 - 414(a)	151.5 - 153
1 - 421(a)	107 - 108.5
1 - 435(a)	184 - 186
1 - 440(a)	194.5 - 195.5
1 - 445(a)	50 - 53
1 - 470(a)	120 - 122
1 - 497(a)	119 - 121
1 - 508(a)	148 - 150
1 - 518(a)	油状物
1 - 537(a)	153 - 155
1 - 548(a)	204 - 206 (分解)
1 - 557(a)	油状物
1 - 568(a)	51 - 53

第 12 表 (続き)

化合物No	物性値 (融点 °C)
2 - 2(a)	134 - 135
2 - 2(b)	160 - 161
2 - 2(n)	184 - 186
2 - 2(o)	180 - 181.5
2 - 3(b)	140.5 - 142
2 - 3(n)	151.5 - 152.5
2 - 3(o)	162.5 - 163
2 - 4(b)	176 - 180
2 - 5(a)	143 - 144
2 - 5(b)	174 - 176
2 - 6(a)	104 - 105
2 - 6(d)	141 - 143
2 - 6(e)	168 - 169
2 - 6(n)	173 - 175
2 - 7(a)	117 - 118
2 - 7(b)	142 - 145
2 - 7(n)	143 - 144
2 - 8(b)	177 - 179
2 - 8(x)	123 - 124
2 - 10(a)	112.5 - 114
2 - 10(b)	143 - 145
2 - 10(n)	163 - 164.5
2 - 10(v)	138 - 141
2 - 11(e)	149 - 150.5
2 - 14(a)	85.5 - 87
2 - 14(b)	150.5 - 153
2 - 17(a)	145 - 147
2 - 17(b)	181 - 183
2 - 18(a)	86 - 87
2 - 18(b)	134 - 136
2 - 19(a)	82 - 83
2 - 19(b)	136 - 138
2 - 20(a)	109 - 110
2 - 20(b)	148 - 149
2 - 24(a)	61 - 63
2 - 24(b)	81 - 83
2 - 26(a)	126.5 - 127.5
2 - 30(a)	177 - 179
2 - 30(b)	174 - 176
2 - 34(a)	156 - 157
2 - 34(b)	181 - 183
2 - 39(e)	126 - 128
2 - 44(b)	162 - 163
3 - 1(a)	160 - 162

第 12 表 (続き)

化合物No	物性値 (融点 °C)
5 - 1(a)	115 - 118
5 - 22(a)	油状物
5 - 23(a)	39 - 42
5 - 34(a)	55 - 58 (分解)
5 - 58(a)	44 - 47
5 - 82(a)	121 - 123
5 - 146(a)	182 - 184
5 - 146(h)	145.5 - 147.5
5 - 153(a)	139 - 140
5 - 165(a)	128 - 129.5
5 - 227(a)	42 - 45
5 - 234(a)	油状物
5 - 247(a)	油状物
5 - 254(a)	68 - 70
5 - 254(h)	油状物
5 - 261(a)	151 - 154
5 - 274(a)	173 - 176
5 - 490(a)	126 - 129
5 - 495(a)	149 - 150.5
5 - 506(a)	145 - 147
6 - 6(a)	163.5 - 164.5
6 - 30(a)	54 - 56
7 - 1(a), (b)	135 - 137 (混合物)
7 - 2(e)	135 - 136
7 - 5(a)	164 - 165
8 - 1(a)	154.5 - 155.5
8 - 10(a)	110.5 - 111
8 - 11(a)	125 - 128
10 - 2(a)	179.5 - 181
11 - 1(a)	81 - 82
11 - 17(a)	89 - 91
11 - 18(a)	62 - 63
11 - 19(a)	121 - 122
11 - 24(a)	133 - 135

本発明化合物の有用性について、以下の試験例において具体的に説明する。但し、これらのみに限定されるものではない。

試験例 1 : キュウリベと病防除効果試験

直径 7 cm のポットで育成した 1. 5 葉期のキュウリ (品種: 相模半白) に、本発明化合物乳剤を水で希釈して 500 ppm に調製した薬液をスプレーガンを

用いポット当たり 20 m² 1 敷布した。

散布翌日キュウリベと病菌 (*Pseudoperonospora cubensis*) の胞子懸濁液 (2 × 10⁵ 個/m²) を噴霧し、温度 25℃、湿度 95% 以上の接種箱に一昼夜入れた。その後、温室におき、接種 7 日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価 100 を示した。

本発明化合物 N o. : 1-1 (a)、1-2 (a)、1-3 (a)、1-4 (a)、1-9 (a)、1-10 (a)、1-11 (a)、1-12 (a)、1-13 (a)、1-14 (a)、1-20 (a)、1-21 (a)、1-22 (a)、1-23 (a)、1-32 (a)、1-33 (a)、1-34 (a)、1-35 (a)、1-38 (a)、1-41 (a)、1-42 (a)、1-43 (a)、1-44 (a)、1-45 (a)、1-50 (a)、1-51 (a)、1-56 (a)、1-62 (a)、1-63 (a)、1-71 (a)、1-72 (a)、1-81 (a)、1-105 (a)、1-118 (a)、1-119 (a)、1-125 (a)、1-126 (a)、1-130 (a)、1-131 (a)、1-133 (a)、1-135 (a)、1-136 (c)、1-148 (a)、1-152 (a)、1-161 (a)、1-163 (a)、1-168 (a)、1-187 (a)、1-188 (a)、1-211 (a)、1-222 (a)、1-232 (a)、1-233 (a)、1-243 (a)、1-258 (a)、1-265 (a)、1-266 (a)、1-276 (a)、1-277 (a)、1-283 (a)、1-289 (a)、1-290 (a)、1-298 (a)、1-311 (a)、1-316 (a)、1-326 (a)、1-343 (a)、1-353 (a)、1-370 (a)、1-378 (a)、1-396 (a)、1-403 (a)、1-414 (a)、1-421 (a)、1-435 (a)、1-440 (a)、1-445 (a)、1-470 (a)、1-497 (a)、1-508 (a)、1-518 (a)、1-537 (a)、1-548 (a)、1-568 (a)、2-2 (a)、2-2 (b)、2-2 (n)、2-2 (o)、2-3 (b)、2-3 (n)、2-3 (o)、2-4 (b)、2-5 (a)、2-

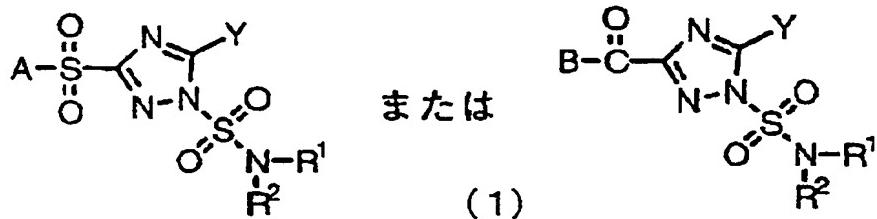
5 (b)、2-6 (a)、2-6 (d)、2-6 (e)、2-6 (n)、2-7
(a)、2-7 (b)、2-7 (n)、2-8 (b)、2-8 (x)、2-10
(a)、2-10 (b)、2-10 (n)、2-10 (v)、2-11 (e)、
2-14 (a)、2-14 (b)、2-17 (a)、2-17 (b)、2-18
(a)、2-18 (b)、2-19 (a)、2-19 (b)、2-20 (a)、
2-20 (b)、2-24 (a)、2-24 (b)、2-26 (a)、2-34
(a)、2-34 (b)、2-39 (e)、2-44 (b)、3-1 (a)、5
-1 (a)、5-22 (a)、5-23 (a)、5-34 (a)、5-58 (a)
、5-82 (a)、5-146 (a)、5-153 (a)、5-165 (a)、
5-227 (a)、5-234 (a)、5-247 (a)、5-254 (a)、
5-261 (a)、5-274 (a)、5-490 (a)、5-495 (a)、
5-506 (a)、6-6 (a)、6-30 (a)、7-1 (a)、(b)、7

産業上の利用可能性

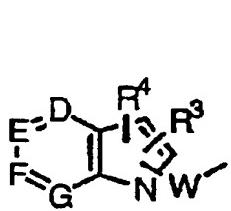
これらの化合物は新規な化合物であり、優れた農園芸用殺菌作用を示し、有用作物に対する薬害も認められないため、農園芸用殺菌剤として有用である。

請求の範囲

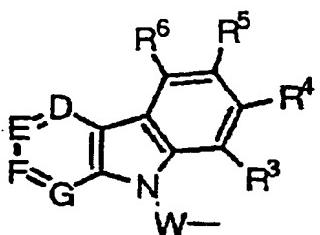
(1) 式 (1)



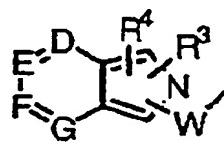
[上記式中、 R^1 、 R^2 はそれぞれ独立して、 $C_1\sim_4$ アルキルまたは R^1 と R^2 と
が一緒にになって $C_4\sim_6$ アルキレン、 $C_4\sim_6$ アルキレンオキシであり、
 Y はH、ハロゲン、 $C_1\sim_8$ アルキル、 $C_1\sim_8$ アルコキシ、 $C_1\sim_8$ アルキルチオ、
 $C_1\sim_8$ ハロアルキル、 $C_1\sim_8$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim_8$ ハロアルキルチオであり、
 A は、



A-1



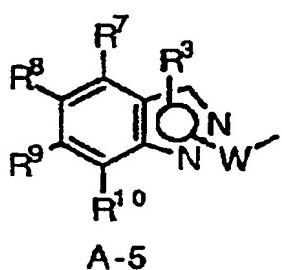
A-2



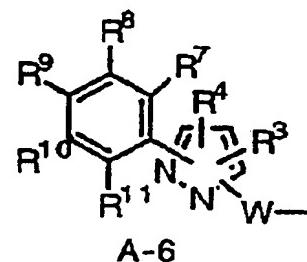
A-3



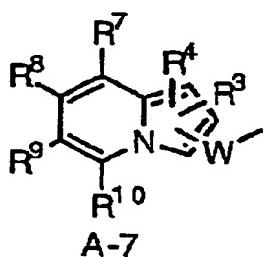
A-4



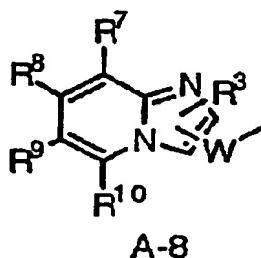
A-5



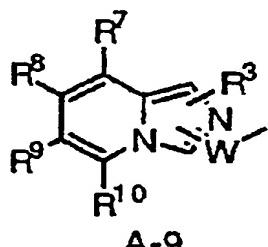
A-6



A-7

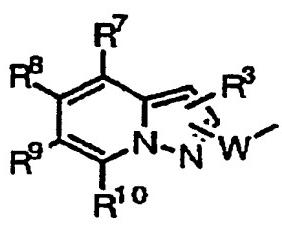


A-8



A-9

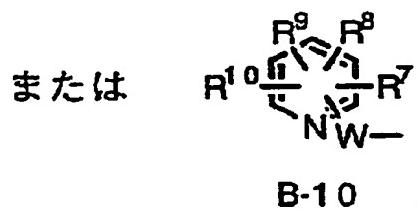
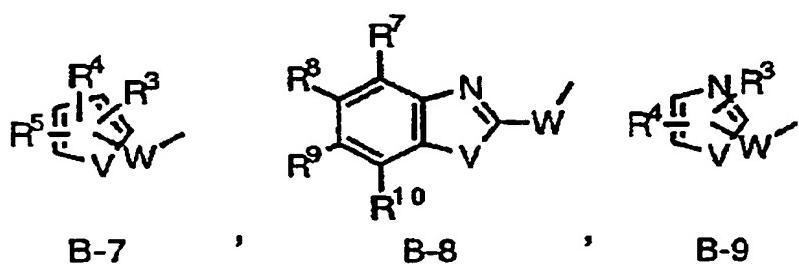
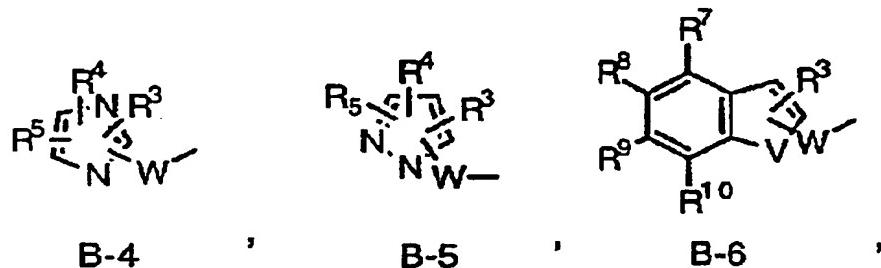
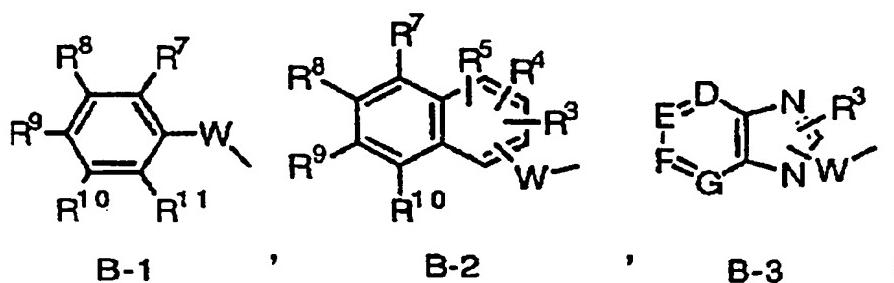
または



A-10

であり、

Bは、A-1ないしA-10、または



であり、

Wは結合またはOであり、

VはOまたはSであり、

D, E, F, Gはそれぞれ独立して、N、CR⁷、CR⁸、CR⁹またはCR¹⁰

であり、

R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} はそれぞれ独立してH、C₁～₈アルキル、C₃～₈シクロアルキル、C₂～₈アルケニル、C₅～₈シクロアルケニル、C₂～₈アルキニル、C₁～₈アルコキシ、C₃～₈シクロアルキルオキシ、C₅～₈シクロアルケニルオキシ、C₂～₈アルケニルオキシ、C₂～₈アルキニルオキシ、C₁～₈アルキルチオ、C₃～₈シクロアルキルチオ、C₅～₈シクロアルケニルチオ、C₂～₈アルケニルチオ、C₂～₈アルキニルチオ、C₁～₈ハロアルキル、C₁～₈ハロアルコキシ、C₁～₈ハロアルキルチオ、C₂～₈ハロアルケニル、C₂～₈ハロアルケニルオキシ、C₂～₈ハロアルケニルチオ、C₂～₈ハロアルキニル、C₂～₈ハロアルキニルオキシ、C₂～₈ハロアルキニルチオ、置換されていても良いフェニル（この置換基の種類は、ハロゲン、C₁～₈アルキル、C₁～₈ハロアルキル、C₁～₈アルコキシ、C₁～₈ハロアルコキシ、C₁～₈アルキルチオ、C₁～₈ハロアルキルチオ、C₁～₈アルキルスルホキシ、C₁～₈アルキルスルホニル、CN、NO₂、C₁～₆アルコキシカルボニルであり、その置換基の数は1～5であり、その置換基は同一かもしくは相異なっていても良い）、置換されていても良いフェニルC₁～₄アルキル、置換されていても良いベンジルチオ、置換されていても良いベンジルオキシ、置換されていても良いフェノキシC₁～₄アルキル、置換されていても良いフェノキシ、置換されていても良いフェニルチオC₁～₄アルキル、置換されていても良いフェニルチオ、置換されていても良いベンゾイル、置換されていても良いベンゾイルC₁～₄アルキル、置換されていても良いベンゾイルオキシ、置換されていても良いベンゾイルオキシC₁～₄アルキル、置換されていても良いナフチル、置換されていても良い5員もしくは6員複素環、C₁～₈ヒドロキシアルキル、C₁～₈ヒドロキシハロアルキル、C₁～₆アルコキシC₁～₄アルキル、C₁～₆ハロアルコキシC₁～₄アルキル、C₁～₆ハロアルキルチオC₁～₄アルキル、C₁～₁₀ジアルコキシC₁～₄アルキル、C₁～₃アルキレンジオキシC₁～₄アルキル、C₁～₆アルキルチオC₁～₄アルキル、C₁～₁₀ジアルキルチオC₁～₄アルキル、C₁～₈アルキレンジチオC₁～₄アルキル、C₁～₆アルコキシカルボニル、C₁～₆ハロアルコキシカルボニル、C₁～₆アルコキシオキザリル、CHO、CO₂H、C₁～₆アルコキシカルボニルC₁～₄アルキル、C₁～₆ハロアルコキシ

カルボニルC₁-₄アルキル、NH₂、C₁-₆アルキルアミノ、C₁-₆アルキルカルボニルアミノ、C₁-₆アルキルカルボニルアミノC₁-₄アルキル、C₁-₆ハロアルキルカルボニルアミノ、C₁-₆ハロアルキルカルボニルアミノC₁-₄アルキル、C₁-₆アルコキシカルボニルアミノ、C₁-₆アルコキシカルボニルアミノC₁-₄アルキル、C₁-₆アルキルスルホニルアミノ、C₁-₆アルキルスルホニルアミノC₁-₄アルキル、C₁-₆ハロアルキルスルホニルアミノ、C₁-₆ハロアルキルスルホニルアミノC₁-₄アルキル、C₁-₆ジアルキルアミノ、C₁-₆ジアルキルアミノC₁-₄アルキル、C₁-₆ジアルキルアミノカルボニル、C₁-₆ジアルキルアミノカルボニルC₁-₄アルキル、C₂-₆アルキレンイミノ、C₂-₆アルキレンイミノC₁-₄アルキル、C₂-₆アルキレンイミノカルボニル、C₂-₆アルキレンイミノカルボニルC₁-₄アルキル、C₁-₆アルキルカルボニル、C₁-₆アルキルカルボニルオキシ、C₁-₆ハロアルキルカルボニル、C₁-₆ハロアルキルカルボニルオキシ、C₁-₆アルキルカルボニルC₁-₄アルキル、C₁-₆アルキルカルボニルC₁-₄アルキル、C₁-₆ハロアルキルカルボニルC₁-₄アルキル、C₁-₆ハロアルキルカルボニルオキシイミノC₁-₄アルキル、ヒドロキシイミノC₁-₄アルキル、C₁-₆アルコキシイミノC₁-₄アルキル、C₁-₆アルキルカルボニルオキシイミノC₁-₄アルキル、C₁-₆アルキルスルホニルオキシイミノC₁-₄アルキル、C₁-₆アルキルスルホキシ、C₁-₆ハロアルキルスルホキシ、C₁-₆アルキルスルホキシC₁-₄アルキル、C₁-₆ハロアルキルスルホキシC₁-₄アルキル、C₁-₆アルキルスルホニル、C₁-₆ハロアルキルスルホニル、C₁-₆アルキルスルホニルC₁-₄アルキル、C₁-₆ハロアルキルスルホニルC₁-₄アルキル、C₁-₆アルキルスルホニルオキシ、C₁-₆ハロアルキルスルホニルオキシ、C₁-₆アルキルスルホニルオキシC₁-₄アルキル、C₁-₆ハロアルコキシスルホニル、C₁-₆ハロアルコキシスルホニルC₁-₄アルキル、C₁-₆ジアルキルスルファモイル、C₁-₆ジアルキルスルファモイルC₁-₄アルキル、C₁-₆アルコキシスルホニル、C₁-₆アルコキシスルホニルC₁-₄アルキル、C₂-₆シアノアルキル、CN、C₁-₆チオカルバモイル、C₁-₆ニトロアルキル、NO₂、ハロゲン、もしくはR³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹のうちの2つが一緒になってハロゲンで置換していく

も良いC₁ - C₈アルキレンジオキシ、またはC₃ - C₈アルキレンである。}で表されるスルファモイル化合物。

- (2) Aが、A-1である請求項1記載のスルファモイル化合物。
- (3) Aが、A-2である請求項1記載のスルファモイル化合物。
- (4) Aが、A-3である請求項1記載のスルファモイル化合物。
- (5) Aが、A-4である請求項1記載のスルファモイル化合物。
- (6) Aが、A-5またはA-6である請求項1記載のスルファモイル化合物。
- (7) Aが、A-7またはA-8である請求項1記載のスルファモイル化合物。
- (8) Aが、A-9またはA-10である請求項1記載のスルファモイル化合物。
- (9) Bが、B-1である請求項1記載のスルファモイル化合物。
- (10) Bが、B-2である請求項1記載のスルファモイル化合物。
- (11) Bが、B-3またはB-4である請求項1記載のスルファモイル化合物。
- (12) Bが、B-5である請求項1記載のスルファモイル化合物。
- (13) Bが、B-6またはB-7である請求項1記載のスルファモイル化合物。
- (14) Bが、B-8またはB-9である請求項1記載のスルファモイル化合物。
- (15) Bが、B-10である請求項1記載のスルファモイル化合物。
- (16) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がC₁ - C₈アルキルチオである請求項1記載のスルファモイル化合物。
- (17) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がC₁ - C₈アルキルである請求項1記載のスルファモイル化合物。
- (18) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がC₁ - C₈ハロアルキルである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(19) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がハロゲンである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(20) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がHである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(21) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がCNである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(22) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-2であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³, R⁴, R⁵, R⁶がいずれもHである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(23) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-4であり、R³, R⁴, R⁵, R⁶のうち少なくとも1つが置換されていても良い、フェニルである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(24) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Bが、B-1である請求項1記載のスルファモイル化合物。

(25) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がC₁₋₈アルキルであり、R⁴がハロゲンである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(26) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³, R⁴がいずれもハロゲンである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(27) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がC₁₋₈アルキルであり、R⁴がHまたはC₁₋₈アルキルである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(28) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がC₁₋₈

ハロアルキルであり、R⁴がH、ハロゲンまたはC₁-₈アルキルである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(29) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がHまたはC₁-₈アルキルであり、R⁴がC₁-₆アルコキシカルボニルである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(30) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がHであり、R⁴がハロゲンである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(31) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがCR⁷、CR⁸、CR⁹、CR¹⁰であり、R³がCNであり、R⁴がHまたはC₁-₈アルキルである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(32) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがいずれもCHであり、R³がC₁-₈アルキルであり、R⁴がハロゲンである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(33) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがいずれもCHであり、R³, R⁴がいずれもハロゲンである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(34) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがいずれもCHであり、R³がC₁-₈ハロアルキルであり、R⁴がHまたはC₁-₈アルキルである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(35) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがいずれもCHであり、R³がMeまたはEtであり、R⁴がClまたはBrである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(36) R¹, R²がMeであり、YがHであり、Wが結合であり、Aが、A-1であり、D, E, F, GがいずれもCHであり、R³がClまたはBrであり、R⁴がClまたはBrである請求項1記載のスルファモイル化合物。

(37) 請求項1ないし36記載のスルファモイル化合物の1種以上を有効成分として含有する農薬。

(3 8) 農薬が、農園芸用殺菌剤である請求項 3 7 記載の農薬。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP98/04808

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁶ C07D403/06, 403/12, 471/04, A01N43/653, 84, 90

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁶ C07D403/06, 403/12, 471/04, A01N43/653, 84, 90

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CA, REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	JP, 7-215971, A (Mitsubishi Chemical Corp.), 15 August, 1995 (15. 08. 95), Claims (Family: none)	1-38
Y	JP, 7-2803, A (Mitsubishi Petrochemical Co.,Ltd.), 6 January, 1995 (06. 01. 95), Claims (Family: none)	1-38
Y	JP, 6-32785, A (Mitsubishi Petrochemical Co.,Ltd.), 8 February, 1994 (08. 02. 94), Claims & WO, 94/01419, A1 & AU, 9345138, A & EP, 603415, A1 & US, 5527818, A	1-38
Y	JP, 63-255269, A (Schering Agrochemicals Ltd.), 21 October, 1988 (21. 10. 88), Full text & EP, 284277, A & AU, 8813318, A & BR, 8801269, A & DK, 8801492, A & FI, 8801321, A & ZA, 8801982, A & PT, 87010, A & CN, 8801622, A & CS, 8801799, A & DD, 284579, A & US, 5045557, A & IL, 85800, A	1-38

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
6 January, 1999 (06. 01. 99)

Date of mailing of the international search report
19 January, 1999 (19. 01. 99)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP98/04808**C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
PX	WO, 97/41113, A1 (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 6 November, 1997 (06. 11. 97), Claims & AU, 9724077, A	1, 6, 37, 38

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP98/04808

A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC))

Int.Cl⁶ C07D 403/06, 403/12, 471/04, A01N 43/653, 84, 90

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC))

Int.Cl⁶ C07D 403/06, 403/12, 471/04, A01N 43/653, 84, 90

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語)
CA, REGISTRY(STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	J P, 7-215971, A (三菱化学株式会社), 15. 08. 95 (15. 08. 95), 請求の範囲 (ファミリーなし)	1-38
Y	J P, 7-2803, A (三菱油化株式会社), 6. 1月. 1995 (06. 01. 95), 請求の範囲 (ファミリーなし)	1-38
Y	J P, 6-32785, A (三菱油化株式会社), 8. 2月. 1994 (08. 02. 94), 請求の範囲& WO, 94/01419, A1&AU, 9345138, A& EP, 603415, A1&US, 5527818, A	1-38

 C欄の続きにも文献が列挙されている。 パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

- 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
- 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
- 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献(理由を付す)
- 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
- 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

06. 01. 99

国際調査報告の発送日

19.01.99

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官(権限のある職員)

富永 保

印

4C 9159

電話番号 03-3581-1101 内線 3454

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP98/04808

C(続き) 関連すると認められる文献		関連する 請求の範囲の番号
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	
Y	J P, 63-255269, A (シェーリング・アグロケミカルズ ・リミテッド), 21. 10月. 1988 (21. 10. 88), 全文&EP, 284277, A&AU, 8813318, A& BR, 8801269, A&DK, 8801492, A& FI, 8801321, A&ZA, 8801982, A& PT, 87010, A&CN, 8801622, A& CS, 8801799, A&DD, 284579, A& US, 5045557, A&IL, 85800, A	1-38
PX	WO, 97/41113, A1 (日産化学工業株式会社), 6. 1 1月. 1997 (06. 11. 97), 請求の範囲& AU, 9724077, A	1, 6, 37, 38